

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
31. Dezember 2003 (31.12.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/000844 A1

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 487/04,
A01N 43/90

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/005159

(22) Internationales Anmeldedatum:
16. Mai 2003 (16.05.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 23 917.7 29. Mai 2002 (29.05.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-
SELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789
Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

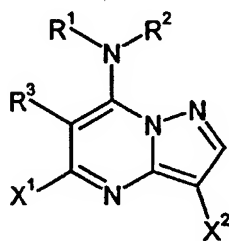
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GEBAUER, Olaf

[DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). GREUL,
Jörg, Nico [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlin-
gen (DE). GAYER, Herbert [AT/DE]; Sandstr. 66, 40789
Monheim (DE). KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE];
Am Vorend 52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). ELBE,
Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal
(DE). DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischer Str. 22, 40789
Monheim (DE). GUTH, Oliver [DE/DE]; Lohrstr. 72c,
51371 Leverkusen (DE). VOERSTE, Arnd [DE/DE];
Salierring 33, 50677 Köln (DE). HILLEBRAND, Stefan
[DE/DE]; Lothringer Strasse 22, 41462 Neuss (DE). HER-
RMANN, Stefan [DE/DE]; Virneburgstr. 4a, 40764 Lan-
genfeld (DE). HEINEMANN, Ulrich [DE/DE]; Am Son-
nenhang 1, 42799 Leichlingen (DE). EBBERT, Ronald
[DE/DE]; Nikolaus-Kopernikus-Str. 13, 40789 Monheim
(DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30 a,
40764 Langenfeld (DE). LÖSEL, Peter [GB/DE]; Lohrstr.
90a, 51371 Leverkusen (DE). WACHENDORFF-NEU-
MANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markweg 85, 56566

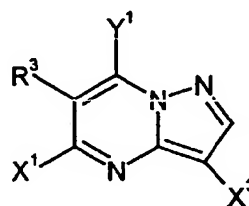
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: PYRAZOLOPYRIMIDINES AND THE USE THEREOF FOR CONTROLLING HARMFUL ORGANISMS

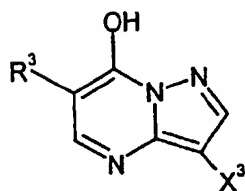
(54) Bezeichnung: PYRAZOLOPYRIMIDINE UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHÄDLICHEN OR-
GANISMEN



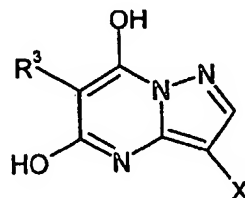
(I)



(II)



(V)



(VI)

(57) Abstract: The invention relates to novel pyrazolopyrimidines of formula (I) wherein R¹, R², R³, X¹ and X² have the designations cited in the description, to a method for producing said substances, and to the use of the same for controlling harmful organisms. The invention also relates to novel intermediates of formulae (II), (V) and (VI), and to methods for producing the same.

(57) Zusammenfassung: Neue Pyrazolopyrimidine der Formel (I), in welcher R¹, R², R³, X¹ und X² die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, ein Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von Schadorganismen. Neue Zwischenprodukte der Formeln (II), (V) und (VI) sowie Verfahren zu deren Herstellung.

BEST AVAILABLE COPY

WO 2004/000844 A1



Neuwied (DE). MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE];
Neuenkamper Weg 48, 42799 Leichlingen (DE).

(74) **Gemeinsamer Vertreter:** BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESELLSCHAFT; Law & Patents, Patents and
Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO,
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,

AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ,
NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK,
SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE,
SN, TD, TG)

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität
einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17
Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

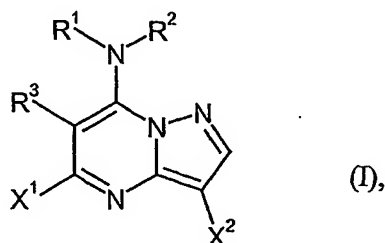
PYRAZOLOPYRIMIDINE UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG
VON SCHÄDLICHEN ORGANISMEN

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Pyrazolopyrimidine, mehrere Verfahren zu
5 ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von schädlichen
Organismen. Die Erfindung betrifft außerdem neue Zwischenprodukte sowie
Verfahren zu deren Herstellung.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Pyrazolopyrimidine fungizide
10 Eigenschaften besitzen (vergleiche DE-A 3 130 633 oder FR-A 2 794 745). Die
Wirkung dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen
Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Pyrazolopyrimidine der Formel

15



in welcher

20 R^1 für Amino, Hydroxy oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl,
Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyl-
oxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkynylamino, Cycloalkyl-
amino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocycl-
steht,

25 R^2 für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl,
Alkynyl oder Cycloalkyl steht, oder

- 2 -

R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden,

R^3 für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

5

X^1 für Wasserstoff oder Halogen steht und

X^2 für Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Formyl, Thiocarbamoyl, Alkoxy-carbonyl, Alkyl-carbonyl, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl steht,

10

sowie Säure-Additionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I),

in denen

15

R^1 für Amino steht,

gefunden.

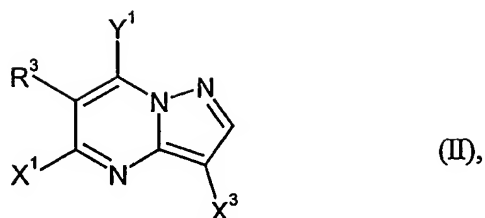
20 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können je nach Substitutionsmuster gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch in Form von Tautomeren vorliegen. Ist R^3 an beiden Atomen, die der Bindungsstelle benachbart sind, ungleich substituiert, können
25 die betreffenden Verbindungen in einer besonderen Form der Stereoisomerie vorliegen und zwar als Atropisomere.

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Pyrazolopyrimidine der Formel (I) herstellen lassen, indem man

30

a) Halogen-pyrazolopyrimidine der Formel

- 3 -



in welcher

R^3 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

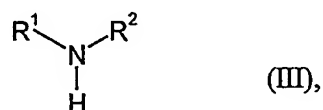
5

X^3 für Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Thiocarbonyl, Alkoxy-carbonyl oder Alkylcarbonyl steht und

Y^1 für Halogen steht,

10

mit Aminen der Formel



in welcher

15

R^1 und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, umgesetzt,

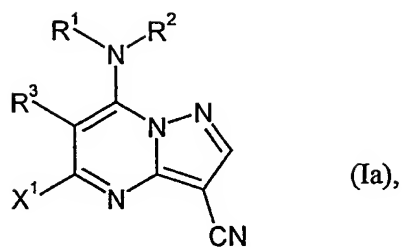
20

oder

b) Pyrazolopyrimidine der Formel (Ia)

25

- 4 -



in welcher

R¹, R², R³ und X¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

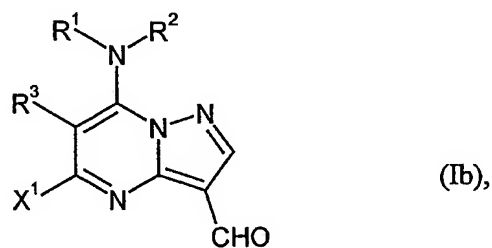
5

mit Diisobutyl-aluminiumhydrid in Gegenwart von wässriger Ammoniumchlorid-Lösung sowie in Gegenwart eines organischen Verdünnungsmittels umgesetzt,

10

oder

c) Pyrazolopyrimidine der Formel (Ib)



15

in welcher

R¹, R², R³ und X¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Amino-Verbindungen der Formel (IV)

20



in welcher

- 5 -

R⁴ für Wasserstoff oder Alkyl steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart
eines Katalysators umgesetzt, wobei die Amino-Verbindungen der Formel (IV)
auch in Form ihrer Säureadditions-Salze eingesetzt werden können,

und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in
denen

R¹ für Amino steht,

eine Säure addiert.

Schließlich wurde gefunden, dass sich die neuen Pyrazolopyrimidine der Formel (I)
bzw. deren Säure-Additionssalze sehr gut zur Bekämpfung von Schadorganismen
eignen. Sie zeigen vor allem eine starke Wirksamkeit gegen unerwünschte
Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien. Außerdem besitzen die erfin-
dungsgemäßen Stoffe auch eine sehr gute insektizide und nematizide Wirkung.

Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Pyrazolopyrimidine der
Formel (I) sowie deren Säure-Additionssalze eine wesentlich bessere Wirksamkeit
gegen Schadorganismen als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Stoffe
gleicher Wirkungsrichtung.

Die erfindungsgemäßen Pyrazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein
definiert.

R¹ steht bevorzugt für Hydroxy, Amino, für gegebenenfalls durch Halogen,
Cyano, Hydroxy, Amino, Phenyl, Heterocyclyl, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlen-
stoffatomen, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil,

- Alkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Dialkylamino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenycycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroxyimino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Halogenalkyl mit 1 bis 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkoxy mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

- 7 -

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Dialkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in jedem der Alkylreste,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

10

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkylamino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

15

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in Alkylteil,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylidenamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

20

oder

für gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Heterocyclyl mit 5 oder 6 Ringgliedern,

25

wobei die zuvor genannten Heterocyclyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

30

Halogen, Hydroxy, Phenyl, 1,2-Dioxyethylen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

- 8 -

Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Halogenalkylthio mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen und wobei die zuvor genannten Heterocyclreste gesättigt oder teilweise ungesättigt sind,

und wobei die zuvor genannten Phenyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy,

- 9 -

Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

5

in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylen-dioxy (-O-CH₂-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen.

10

R² steht bevorzugt für Wasserstoff,

15

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroximino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

20

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkynyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder

25

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

30

R¹ und R² stehen auch bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Ring, der gesättigt oder teilweise gesättigt ist, der neben dem bereits erwähnten Stick-

- 10 -

- stoffatom noch ein weiteres Heteroatom aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und der einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch
- Halogen, Hydroxy, Cyano, Morpholinyl, Amino, einen annelierten Phenyl-
5 ring, eine Methylen- oder Ethylenbrücke,
Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,
Alkylcarbonylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil,
10 Dialkylamino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen,
Alkoxycarbonylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil,
Di(alkoxycarbonyl)amino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen in den Alkoxyteilen,
Hydroxyalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil und/oder
15 Alkylcarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.
- R³ steht bevorzugt für Phenyl, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch
- 20 Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;
- 25 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1
- 30

bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

5 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

10 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

15 in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH₂-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen
20 Halogenatomen.

X¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Brom.

25 X² steht bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro, Formyl, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Thiocarbamoyl, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, Alkylcarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Hydroximinoalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen
30 im Alkylteil oder für Alkoxyiminoalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.

- 5 R¹ steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, i-Pentyl, 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, oder
- 10 R¹ steht besonders bevorzugt für Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthiomethyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Acetylmethyl, 2-Hydroximino-propyl, 2-Methoximino-propyl, Allyl, 2-Methylprop-2-enyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(Trifluormethyl)-ethyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, Cyclopropylmethyl,
- Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Difluoromethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy,
- 15 Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Trifluorethylamino, Cyclohexylmethylamino, 2-Cyanoethylamino, Allylamino, 1-Cyclopropylethylamino, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, 1-Methylethylidenamino,
- 20 für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Methyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Thiamorpholinyl, Piperazinyl oder
- 25 für gegebenenfalls substituiertes Pyridylmethoxy oder Thiazolylmethoxy,
- oder
- 30 R¹ steht besonders bevorzugt für (2,2-Dichlorcyclopropyl)methyl, (2-Furyl)methyl, (2-Tetrahydrofuryl)methyl, (2-Tetrahydropyranyl)methyl, 1,3-Dioxo-

- 13 -

lan-2-ylmethyl, 1-Cyclopropylethyl, Benzyloxy, 2,4-Dichlorbenzyloxy, 2,6-Dichlorbenzyloxy, 2-Chlorbenzyloxy, 2-Fluorcyclopropyl, 2-Hexahydropyranyloxy, 2-Thienylmethyl, 2-Trifluormethylcyclohexyl, 3-(Dimethylamino)-propyl, 3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl, 3,5-Dichlorbenzyloxy, 3-Aminopropyl, 3-Chlorbenzyloxy, 3-Trifluormethylbenzyloxy, 3-Trifluormethylcyclohexyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl, 4-Chlorbenzyloxy, 4-Fluorbenzyloxy, 4-Trifluormethylbenzyloxy, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CF}_3$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-COCH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})\text{-COOCH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}(\text{O-CH}_3)_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH=CH}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-O-CH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-OH}$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-COOCH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-COO-t-butyl}$, $-\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$, $-\text{CH}_2\text{-CH}(\text{OCH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-Cl}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CN}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{-CHF}_2$, $-\text{CH}_2\text{-CN}$, $-\text{CH}_2\text{-COOC}_2\text{H}_5$, $-\text{CH}_2\text{-COOCH}_3$, i-Butoxy, $-\text{NH-CH}_2\text{-CF}_2\text{-CHF}_2$, $-\text{NH-CH}_2\text{-CF}_3$, $-\text{NH-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, t-Butoxy oder $-\text{O-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_3$,

wobei die zuvor genannten Thiazolyl- und Pyridyl-Reste im Falle von Thiazolyl einfach oder zweifach und im Falle von Pyridyl einfach bis dreifach, jeweils gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Dichlorfluormethylthio, Trifluormethylthio und/oder Phenyl,

und wobei die zuvor genannten Benzyloxy-Reste im Phenylteil einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propyl-

thio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methyl-
5 amino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

10 in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, Methylendioxy (-O-CH₂-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl.

15 R² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthiomethyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Acetylmethyl, 2-Hydroxyimino-propyl, 2-Methoxyimino-propyl, Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluormethyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutyl-
20 methyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl.

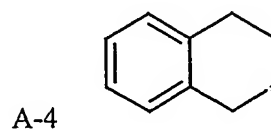
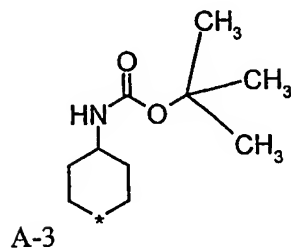
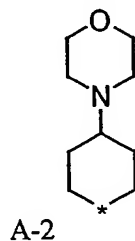
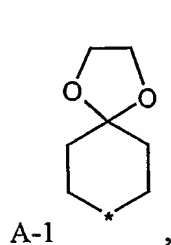
R¹ und R² stehen besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an
welches sie gebunden sind, für 1-Pyrrolinyl, 3-Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl,
25 Dihydropyridinyl, Piperidinyl, Pyrazolinyl, Pyrazolidinyl, Imidazolinyl, Imidiazolidinyl, 1,2-Diazinan-yl, 1,3-Diazinan-yl, Piperazinyl, Oxazolinyl, Oxazolidinyl, Isoxazolyl, Isoxazolidinyl, Tetrahydropyridazinyl, Dihydrooxazinyl, Morpholinyl, Thiazolinyl, Thiazolidinyl oder Thiomorpholinyl, wobei die genannten Heterocyclen substituiert sein können durch

- 15 -

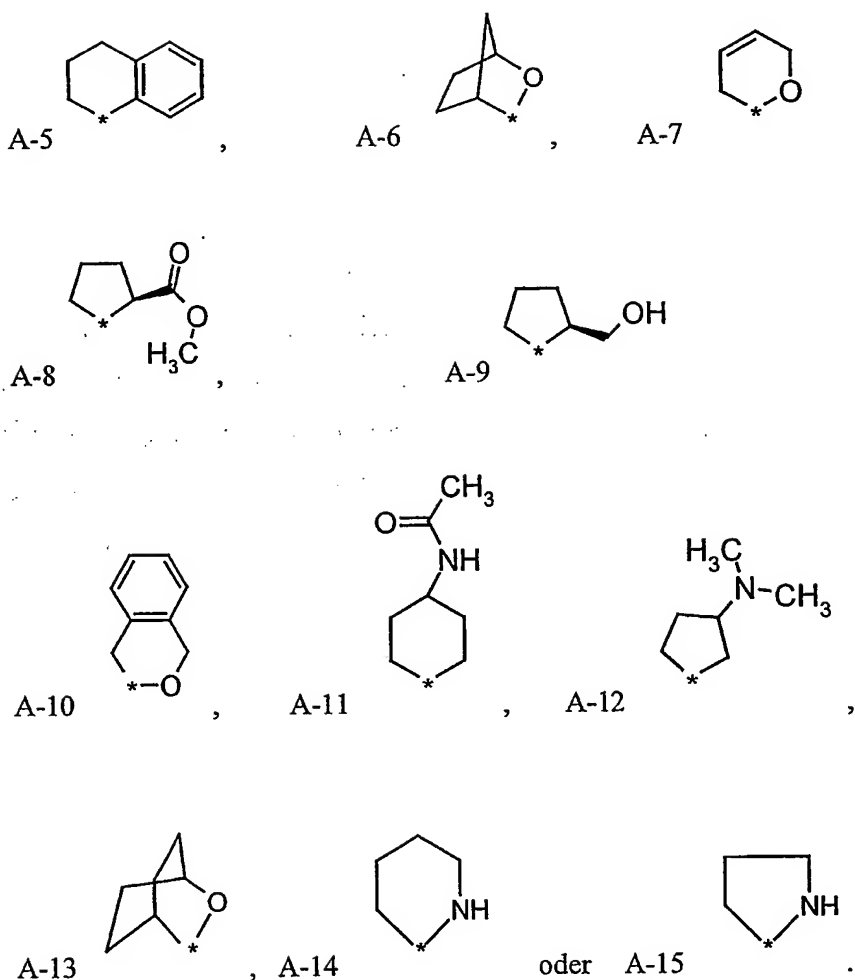
Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxa, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, durch einen annelierten Phenylring oder durch eine Methandiyl- oder Ethandiyl-Brücke,

oder

R¹ und R² stehen besonders bevorzugt gemeinsam für eine Gruppierung der Formel



- 16 -



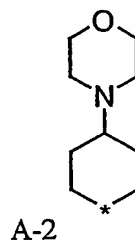
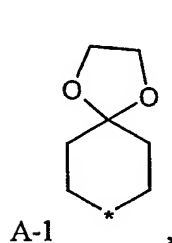
In diesen Gruppierungen ist die mit dem Stickstoffatom verbundene Stelle jeweils
 10 durch * bezeichnet.

R³ steht besonders bevorzugt für Phenyl, das einfach bis dreifach, gleichartig
 oder verschieden substituiert sein kann durch

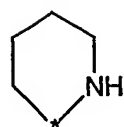
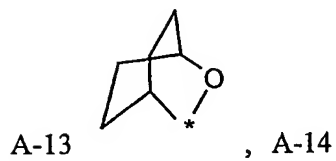
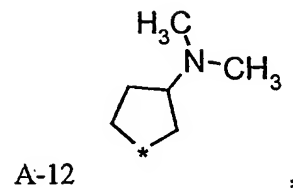
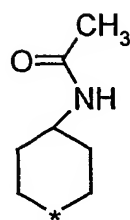
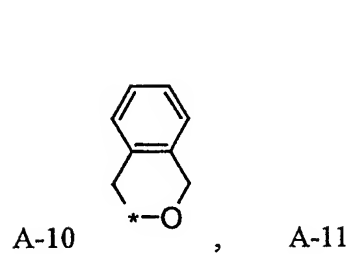
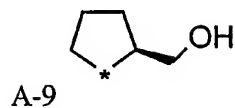
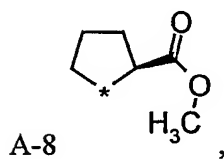
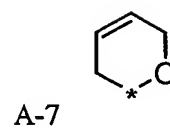
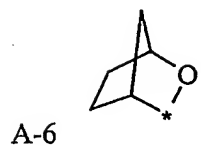
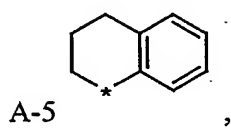
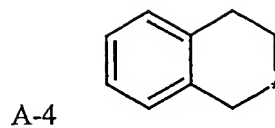
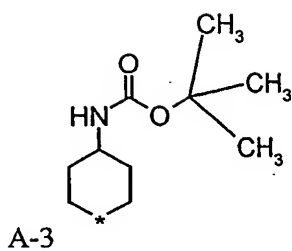
15 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl,
 n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy,
 Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl,
 Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl,
 Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy,

- Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,
- in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, Methylendioxy (-O-CH₂-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH₂-CH₂-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl.
- X¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor oder Chlor.
- X² steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Formyl, Trifluormethyl, Methoxycarbonyl, Methylcarbonyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Thiocarbamoyl, Nitro, Methyl, Ethyl oder Cyclopropyl.
- R³ steht ganz besonders bevorzugt für 2,4-, 2,5- oder 2,6-disubstituiertes Phenyl, oder für 2-substituiertes Phenyl oder für 2,4,6-trisubstituiertes Phenyl.
- Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe sind Verbindungen der Formel (I), in welcher
- R¹ für Amino, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, t-Butyl, 1,2-Dimethyl-propyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, Trifluormethyl, 2,2,2-Trifluormethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl, 3,3,3-Trifluor-propyl, 2,2,2-Trifluor-1,1-dimethyl-ethyl, 3-Methyl-butyl, Allyl, 2-Methyl-prop-2-enyl, 2-Methoxyethyl, 2,2-Dimethoxy-

- ethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, 2-Fluorocyclopropyl, 2-Trifluormethyl-cyclohexyl, 3-Trifluormethyl-cyclohexyl, 4-Trifluormethyl-cyclohexyl, 3,5-Di(trifluormethyl)-cyclohexyl, Cyclopropyl-methyl, Dichlorocyclopropyl-methyl, 1-Cyclohexyl-ethyl, 2-Furyl-methyl, 2-Tetrahydrofuryl-methyl, 2-Thienyl-methyl, 1,3-Dioxolan-2-yl-methyl, Propargyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, 2-Amino-ethyl, 3-Amino-propyl, 2-Dimethylamino-ethyl, Cyanomethyl, 2-Cyano-ethyl, 2-Vinyloxy-ethyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Thiomorpholinyl oder Piperazinyl steht,
- 10 R² für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluormethyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl oder Cyclopropyl steht oder
- 15 R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methylcarbonyl, Methylcarbonylamino oder Methoxycarbonyl substituiertes Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Thiomorpholinyl, Piperazinyl, 5-Methyl-3,6-dihydro-1(2H)-pyridinyl, 5-Ethyl-3,6-dihydro-1-(2H)-pyridinyl
- 20 oder Tetrahydro-1-(2H)-pyridazinyl stehen oder für eine Gruppierung der Formel



- 19 -



stehen,

R³ für einfach bis dreifach in 2-, 4- und/oder 6-Position durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Phenyl steht,

oder

R³ für 2-Trifluormethylphenyl, 2-Chlor-5-nitro-phenyl oder 2-Chlor-4-methoxy-phenyl steht,

5

X¹ für Wasserstoff oder Chlor steht und

X² für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Cyclopropyl, Formyl, Thiocarbamoyl oder Methoximinomethyl steht.

10

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Bedeutungen entfallen.

Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen sind auch Additionsprodukte aus Säuren und denjenigen Pyrazolopyrimidinen der Formel (I), in denen

15

R¹ für Amino steht und

R², R³, X¹ und X² diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

20

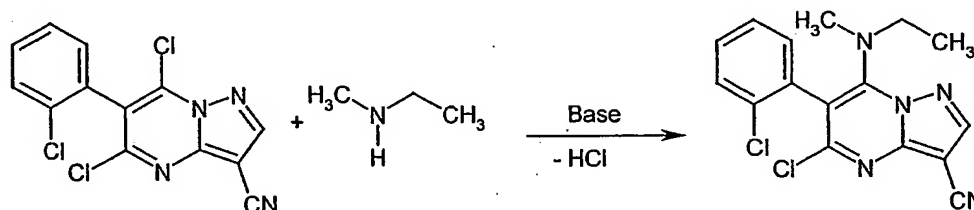
Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z.B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Salpetersäure, mono- und bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z.B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z.B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

25

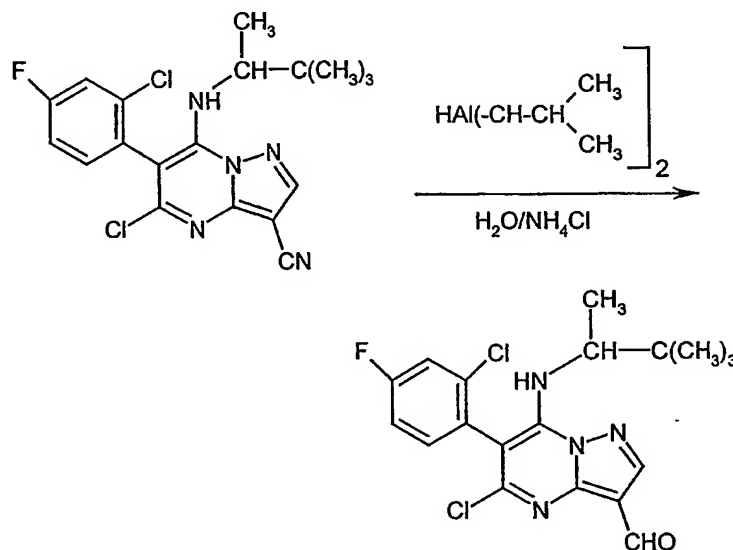
- 21 -

Die oben aufgeführten allgemein oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte.

- 5 Verwendet man 3-Cyano-5,7-dichlor-6-(2-chlor-phenyl)-pyrazolo[1,5-a]-pyrimidin und Methyl-ethyl-amin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

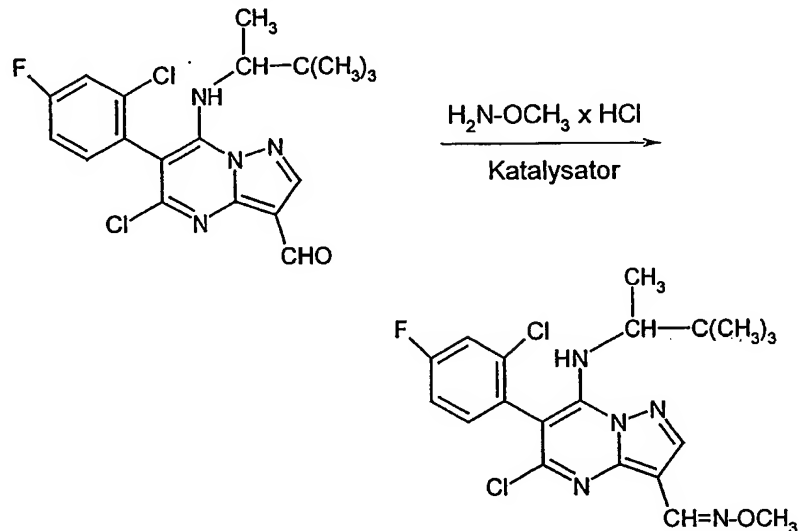


- 10 Verwendet man 3-Cyano-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-7-(1,2,2-trimethylpropylamino)-pyrazolo[1,5a]pyrimidin als Ausgangsstoff und Di-isobutyl-aluminiumhydrid als Reaktionskomponente, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- 22 -

Verwendet man 3-Formyl-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-7-(1,2,2-trimethyl-propylamino)-pyrazolo-[1,5a]pyrimidin und Methoxyamin-hydrochlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



5

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenpyrazolopyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben R^3 und X^1 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden. Y^1 steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

- 15 X^3 steht vorzugsweise für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Nitro, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Thiocarbonyl, Alkoxy-carbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil oder Alkyl-carbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil.
- 20

- 23 -

X³ steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Trifluormethyl, Methoxycarbonyl, Methylcarbonyl, Thiocarbamoyl, Nitro, Methyl, Ethyl oder Cyclopropyl.

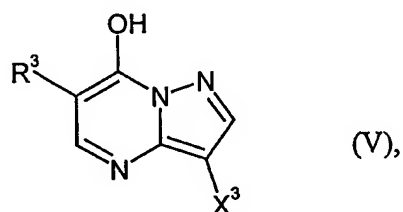
5 X³ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Nitro, Methyl, Cyclopropyl oder Thiocarbamoyl.

Die Halogenpyrazolopyrimidine der Formel (II) sind neu. Auch diese Stoffe eignen sich zur Bekämpfung von Schädlingen, insbesondere zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Die Halogen-pyrazolopyrimidine der Formel (II) lassen sich herstellen,

indem man

15 d) Hydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel



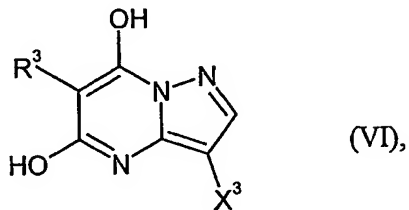
in welcher

20 R³ und X³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

25 oder

e) Dihydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel



in welcher

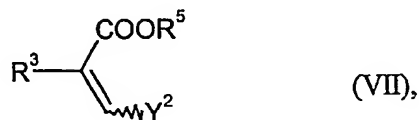
R³ und X³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxy-pyrazolopyrimidine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel haben R³ und X³ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formeln (I) und (II) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

Auch die Hydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel (V) sind bisher noch nicht bekannt. Sie lassen sich herstellen, indem man

f) Acrylsäureester der Formel



in welcher

R³ die oben angegebene Bedeutung hat,

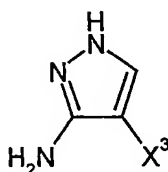
- 25 -

R⁵ für Alkyl steht und

Y² für Alkoxy oder Dialkylamino steht,

5

mit Aminopyrazolen der Formel



(VIII),

in welcher

10

X³ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer starken Base umgesetzt.

15

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Acrylsäureester sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel hat R³ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden. R⁵ steht vorzugsweise für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, besonders bevorzugt für Methyl oder Ethyl. Y² steht vorzugsweise für Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für Dialkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in jeder Alkylgruppe. Besonders bevorzugt steht Y² für Methoxy, Ethoxy oder für Dimethylamino.

25

Die Acrylsäureester der Formel (VII) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. EP-A 0 165 448).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Reaktionskomponenten benötigten Aminopyrazole sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel hat X^3 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (II) für diesen Substituenten als bevorzugt genannt wurden.

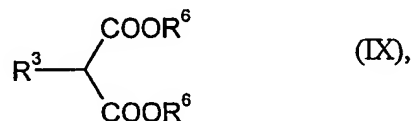
Die Aminopyrazole der Formel (VIII) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. Tetrahedron Lett. 21, 2029-2031 (1967); Liebigs Ann. Chem. 707, 141-146 (1967), Monatsh. Chem. 1998, 1329 (12), 1313-1318) und J. Med. Chem. 25 (1982), 239 ff).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxy-pyrazolo-pyrimidine sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel haben R^3 und X^3 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formeln (I) und (II) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

Auch die Dihydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel (VI) sind bisher noch nicht bekannt. Sie lassen sich herstellen, indem man

20

g) Malonester der Formel



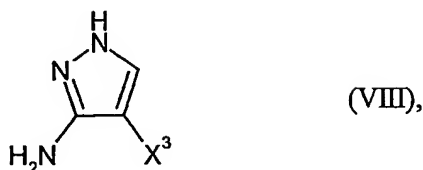
in welcher

25

R^3 die oben angegebenen Bedeutung hat und

R^6 für Alkyl steht,

mit Aminopyrazolen der Formel



in welcher

X^3 die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer starken Base umgesetzt.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten Malonester sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel hat R^3 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden. R^6 steht vorzugsweise für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, besonders bevorzugt für Methyl oder Ethyl.

Die Malonester der Formel (IX) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. US-A 6 156 925).

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (f) und (g) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxy-

ethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethyl-
5 sulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether; Amine, wie Tri-n-butylamin oder Carbonsäuren, wie Essigsäure.

10 Als starke Basen kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (f) und (g) vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetall-hydride oder -alkoholate sowie Alkalimetallamide in Frage. Beispielhaft genannt seien Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat und Kalium-tert.-butylat.

15 Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (f) und (g) sowie auch bei der Durchführung der anderen erfindungsgemäßen Verfahren arbeitet man im Allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck oder, -sofern keine leicht flüchtigen Reaktionskomponenten enthalten sind-, unter vermindertem Druck zu arbeiten.

20 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (f) und (g) jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei Abwesenheit von Basen arbeitet man im Allgemeinen bei Temperaturen zwischen 100°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 120°C und 200°C. Bei Anwesenheit von
25 Basen arbeitet man im Allgemeinen bei Temperaturen zwischen 20°C und 120°C, vorzugsweise zwischen 20°C und 80°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) setzt man auf 1 Mol an Acrylsäureester der Formel (VII) im Allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 1 bis
30 8 Mol an Aminopyrazol der Formel (VIII) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) setzt man auf 1 Mol an Malonester der Formel (IX) im Allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 1 bis 8 Mol an Aminopyrazol der Formel (VIII) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Als Halogenierungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) jeweils alle üblichen Reagenzien in Betracht, die für einen Austausch von an Kohlenstoff gebundene Hydroxygruppen gegen Halogen geeignet sind. Vorzugsweise verwendbar sind Phosphortrichlorid, Phosphortribromid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Phosgen, Thionylchlorid, Thionylbromid oder deren Gemische. Die entsprechenden Fluor-Verbindungen der Formel (II) lassen sich aus den Chlor- oder Brom-Verbindungen durch Umsetzung mit Kaliumfluorid herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) jeweils alle für derartige Halogenierungen üblichen organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan.

Als Verdünnungsmittel kann aber auch das Halogenierungsmittel selbst oder ein Gemisch aus Halogenierungsmittel und einem der genannten Verdünnungsmittel dienen.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 20°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 40°C und 120°C.

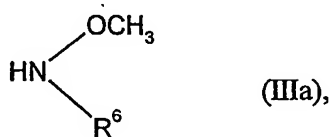
- 30 -

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahrens (d) und (e) setzt man auf
 1 Mol an Hydroxypyrazolopyrimidin der Formel (V) bzw. an Dihydroxy-pyrazolo-
 pyrimidin der Formel (VI) jeweils einen Überschuß an Halogenierungsmittel ein. Die
 5 Aufarbeitung erfolgt jeweils nach üblichen Methoden.

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Aus-
 gangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In
 dieser Formel haben R^1 und R^2 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im
 10 Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der
 Formel (I) für R^1 und R^2 als bevorzugt angegeben wurden.

Die Amine der Formel (III) sind teilweise bekannt.

15 Neu sind Amine der Formel



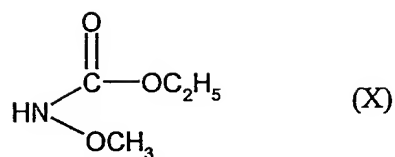
in welcher

20 R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---C=CH}_2 \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ steht.

Die Amine der Formel (IIIa) lassen sich herstellen, indem man

h) in einer ersten Stufe N-Methoxycarbaminsäure-ethylester der Formel
 25

- 31 -



mit Halogenverbindungen der Formel



5

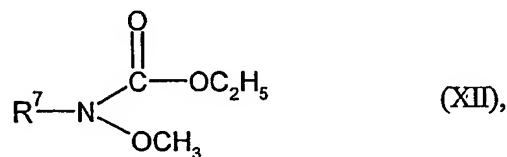
in welcher

R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

10

X^4 für Brom oder Iod steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt
und die entstehenden Carbamate der Formel



15

in welcher

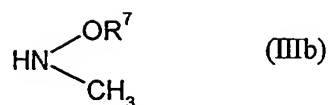
R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und
Wasser umgesetzt.

Neu sind auch Amine der Formel

- 32 -



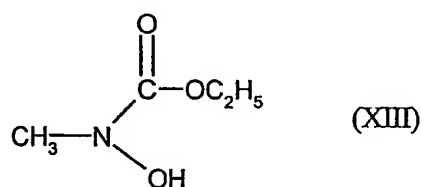
in welcher

 R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat.

5

Die Amine der Formel (IIIb) lassen sich herstellen, indem man

- i) in einer ersten Stufe N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel



10

mit Halogenverbindungen der Formel



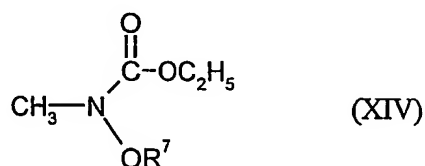
15

in welcher

 R^7 und X^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel

20



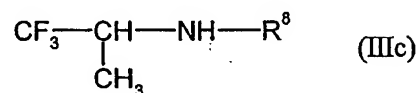
in welcher

- 33 -

R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und
 5 Wasser umgesetzt.

Neu sind auch Trifluorisopropylamine der Formel



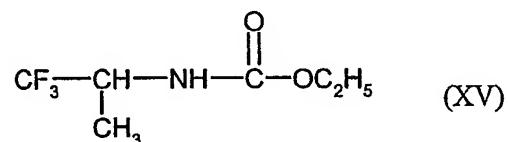
10 in welcher

R^8 für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

Die Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc) lassen sich herstellen, indem man

15

j) in einer ersten Stufe N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel



mit Halogenverbindungen der Formel

20



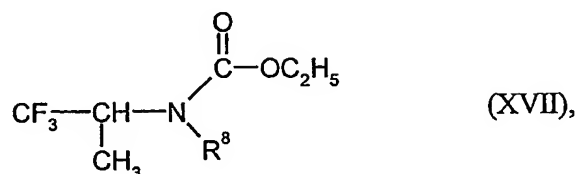
in welcher

25

R^8 und X^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 34 -

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt .
und die entstehenden Carbamate der Formel

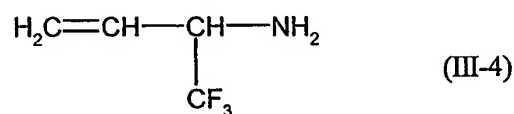


5 in welcher

R^8 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und
10 Wasser umgesetzt.

Neu ist schließlich auch das 3-Trifluor-methyl-3-amino-propen der Formel

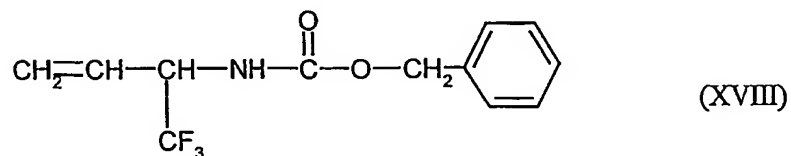


15

Das 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel (III-4) lässt sich herstellen, indem
man

k) das Carbat der Formel

20



mit wässriger Salzsäure umgesetzt.

Die bei der Durchführung der Verfahren (h)-(j) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formeln (X), (XI), (XIII), (XV), (XVI) und (XVIII) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

- 5 Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (h), (i) und (j) kommen jeweils alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Säureakzeptoren in Frage.

10 Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat. Als organische Basen
15 seien genannt: tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

20 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der ersten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) jeweils alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Ether, wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid oder N-Methylpyrrolidon; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, tert. Butanol, n-Butanol.

30 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der ersten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden.

Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 100°C.

5 Bei der Durchführung der ersten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem Druck oder, sofern keine niedrig siedenden Komponenten an der Umsetzung beteiligt sind, unter vermindertem Druck zu arbeiten.

10 Bei der Durchführung der ersten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) setzt man

- auf 1 mol an N-Methoxy-carbaminsäure-ethylester der Formel (X) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (XI) ein, bzw.
- 15 • auf 1 mol an N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (XI) ein, bzw.
- 20 • auf 1 mol an N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XV) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (XVI) ein.

25 Die Aufarbeitung erfolgt jeweils nach üblichen Methoden, beispielsweise durch Extraktion und anschließende Trocknung oder durch Fällung mit anschließender Filtration und Trocknung. Gegebenenfalls noch vorhandene Verunreinigungen können nach üblichen Methoden entfernt werden.

30 Die bei der Durchführung der ersten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) als Zwischenprodukte erhaltenen Verbindungen der Formeln (XII), (XIV) und (XVII) sind neu.

Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) können die Reaktionstemperaturen jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 80°C.

5

Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) arbeitet man im Allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch wiederum möglich, jeweils auch unter erhöhtem Druck oder, sofern die zu isolierenden Produkte keine sehr niedrigen Siedepunkte aufweisen, unter vermindertem Druck zu arbeiten.

10

Bei der Durchführung der zweiten Stufe der Verfahren (h), (i) und (j) setzt man auf 1 mol an einer Verbindung der Formel (XII), (XIV) oder (XVII) jeweils bis zu 10 mol an Kaliumhydroxid ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Dabei werden die Amine zweckmäßigerweise im Allgemeinen durch Hinzufügen von

15

Säure, vorzugsweise wässriger Salzsäure, in Form ihrer Salze isoliert.

Bei der Durchführung des Verfahrens (k) können die Reaktionstemperaturen ebenfalls in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 10°C und 150°C, vorzugsweise bei Rückflusstemperatur.

20

Im Allgemeinen arbeitet man bei der Durchführung des Verfahrens (k) unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

25

Bei der Durchführung des Verfahrens (k) setzt man auf 1 mol an Carbamat der Formel (XVIII) einem Überschuss, vorzugsweise bis zu 10 mol an wässriger Salzsäure ein. Die Aufarbeitung erfolgt wiederum nach üblichen Methoden.

30

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie

Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid oder N-Methylpyrrolidon; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

10 Als Katalysatoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens alle für derartige Umsetzungen üblichen Reaktionsbeschleuniger in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkalimetallfluoride, wie Kaliumfluorid oder Caesiumfluorid.

15 Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Umsetzungen üblichen Säurebindemittel in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Ammoniak sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

20 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 mol an Halogen-pyrazolo-pyrimidin der Formel (II) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Pyrazolopyrimidine sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel haben R^1 , R^2 , R^3 und X^1 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

Bei den Pyrazolopyrimidinen der Formel (Ia) handelt es sich um erfindungsgemäße Stoffe, die sich nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) herstellen lassen.

10 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Dichlormethan, Chloroform oder Tetrachlorkohlenstoff.

15 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) innerhalb eines bestimmten Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -80°C und $+20^{\circ}\text{C}$, vorzugsweise zwischen -60°C und $+10^{\circ}\text{C}$.

20 Im Allgemeinen arbeitet man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man auf 1 mol an Pyrazolopyrimidin der Formel (Ia) im Allgemeinen eine äquivalente Menge oder auch einen Überschuss, vorzugsweise 1,1 bis 1,2 mol an Di-isobutyl-aluminiumhydrid ein und fügt anschließend einen Überschuss an wässriger Ammoniumchlorid-Lösung hinzu. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im Allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch ansäuert, die organische Phase abtrennt, die wässrige Phase mit einem mit Wasser wenig mischbaren

25
30

organischen Solvens extrahiert, die vereinigten organischen Phasen wäscht, trocknet und unter vermindertem Druck einengt.

5 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Pyrazolopyrimidine sind durch die Formel (Ib) allgemein definiert. In dieser Formel haben R^1 , R^2 , R^3 und X^1 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

10 Bei den Pyrazolopyrimidinen der Formel (Ib) handelt es sich um erfindungsgemäße Stoffe, die sich nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (b) herstellen lassen.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Reaktionskomponenten benötigten Amino-Verbindungen sind durch die Formel (IV) allgemein
15 definiert. In dieser Formel steht R^4 vorzugsweise für Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

Als Reaktionskomponenten in Betracht kommen auch Säureadditions-Salze, vorzugsweise Chlorwasserstoff-Additions-Salze von Amino-Verbindungen der Formel (IV).
20

Sowohl die Amino-Verbindungen der Formel (IV) als auch deren Säureadditions-Salze sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

25 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol oder Isopropanol.

Als Katalysatoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen Reaktionsbeschleuniger in Betracht.
30 Vorzugsweise verwendbar sind saure oder basische Katalysatoren, wie z.B. der unter

der Bezeichnung Amberlyst A-21® im Handel befindliche, schwach basische Ionenaustaucher.

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) innerhalb eines bestimmten Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 60°C.

10 Im Allgemeinen arbeitet man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

15 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) setzt man auf 1 mol an Pyrazolopyrimidin der Formel (Ib) im Allgemeinen eine äquivalente Menge oder einen Überschuss, vorzugsweise zwischen 1,1 und 1,5 mol an Amino-Verbindung der Formel (IV) oder eines Säureadditions-Salzes davon ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im Allgemeinen geht man so vor, dass man das Reaktionsgemisch gegebenenfalls filtriert, dann einengt und reinigt.

20 Zur Herstellung von Säureadditions-Salzen von Pyrazolopyrimidinen der Formel (I) kommen vorzugsweise diejenigen Säuren in Frage, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Säureadditions-Salze als bevorzugte Säuren genannt wurden.

25 Die Säureadditions-Salze der Verbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, z.B. durch Lösen einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten inerten Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure, z.B. Chlorwasserstoffsäure, erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen
30 Lösungsmittel gereinigt werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen.

- 5 Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

- 10 Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

- 15 Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp..

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera* spp..

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

- 20 Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

- 25 Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

- 30 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..

Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp..

- 5 Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella occidentalis*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

- 10 Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.
- 15

- Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.
- 20
- 25

- Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes*
- 30

chrysocephala, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*,
Anthonomus spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*,
Ceuthorrhynchus assimilis, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp.,
Anthrenus spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus*
5 *hololeucus*, *Gibbium psylloides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp.,
Conoderus spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra*
zealandica, *Lissorhoptrus oryzophilus*.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp.,
10 *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.,
Drosophila melanogaster, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*,
Lucilia spp., *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp.,
15 *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Biblio*
hortulanus, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*,
Dacus oleae, *Tipula paludosa*, *Hylemyia* spp., *Liriomyza* spp..

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..
20

Aus der Klasse der Arachnida z.B. *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*, *Acarus*
siro, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*,
Phyllocoptruta oleivora, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp.,
Hyalomma spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp.,
25 *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp.,
Hemitarsonemus spp., *Brevipalpus* spp..

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. *Pratylenchus* spp., *Radopholus*
similis, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Globodera*
30 spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp.,
Trichodorus spp., *Bursaphelenchus* spp..

Die Wirkstoffe lassen sich mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Insekten, wie beispielsweise gegen die Raupen der Kohlschabe (*Plutella maculipennis*), einsetzen.

5

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen auch eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

10 Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

15 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomyetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen genannt, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen:

20

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

25 *Erwinia*-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;

Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;

30

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder

- Pseudoperonospora cubensis;
- Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;
- 5 Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;
- Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;
- 10 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;
- Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;
- 15 Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;
- Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea
- 20 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
- Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus
- (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
- 25 Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;
- Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;
- 30 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;

5 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;

10

Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;

Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;

15 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;

20

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

25

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, daß die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

30

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der erfindungsgemäßen Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Fusarium-Arten, von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia-, Alternaria-Arten, oder von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen Pyricularia-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide sowie zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen können Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder

Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützba-
ren oder nicht schützba-
ren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasser-

- 50 -

kreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie Alternaria tenuis,

Aspergillus, wie Aspergillus niger,

Chaetomium, wie Chaetomium globosum,

Coniophora, wie Coniophora puetana,

Lentinus, wie Lentinus tigrinus,

Penicillium, wie Penicillium glaucum,

Polyporus, wie Polyporus versicolor,

Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,

Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,

Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,

Escherichia, wie *Escherichia coli*,

5

Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,

Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

10 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

15

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln
20 und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen,
25 Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint,
30 welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und

Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaum erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiemittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im Allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei syner-

gistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

5

Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

10

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

15

Calciumpolysulfid, Carpropamid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

20

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

25

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

30

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenhexamid, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Fluoxastrobin,

Guazatin,

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

5

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Iprovalicarb, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

10

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

15

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

20

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

25

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur, Prothioconazole,

Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine

30

- 55 -

- Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol,
Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,
Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol,
Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
5 Uniconazol,
Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
10 Zarilamid, Zineb, Ziram sowie
Dagger G,
OK-8705,
15 OK-8801,
 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
20 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor- β -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-
25 triazol-1-ethanol,
(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
(E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
30 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,

- 56 -

- 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
- 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
- 5 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
- 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
- 10 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
- 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
- 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
- 15 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4-trifluormethyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
- 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidiny-thiocyanat,
- 20 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
- 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
- 2-(2,3,3-Triod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
- 25 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
- 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
- 30 2-Aminobutan,

- 57 -

- 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
- 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
- 5 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
- 2-Phenylphenol(OPP),
- 10 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
- 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
- 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
- 15 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
- 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
- 20 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
- 8-Hydroxychinolinsulfat,
- 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
- 25 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
- cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
- 30 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,

- Ethyl-[(4-chlorophenyl)-azo]-cyanoacetat,
- Kaliumhydrogencarbonat,
- 5 Methantetrathiol-Natriumsalz,
- Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
- 10 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
- Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
- N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
- 15 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
- N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
- 20 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
- N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
- N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
- 25 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropanecarboxamid,
- N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
- 30 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,

- 59 -

N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,

5 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,

S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,

spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,

10

4-[3,4-Dimethoxyphenyl]-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

Bakterizide:

15 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Othilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

20

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

25 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

30

- 60 -

- Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, 5 Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,
- Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, 10 Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,
- Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, 15 Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocycythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,
- 20 Granuloseviren
- Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,
- Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin, 25 Kernpolyederviren
- Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
- 30 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,

- 61 -

Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin,
Milbemycin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

5

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,
Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,
10 Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat,
Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion,
Pirimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

15

Ribavirin

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

20 Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,
Tefluthrin, Temephos, Temvinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon Theta-
cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam
hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,
Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon,
25 Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

30

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

- (1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat
- 5 (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat
- 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin
- 10 2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
- 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
- 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 15 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 3-Methylphenyl-propylcarbamate
- 20 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
- 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon
- 25 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorophenyl)-3(2H)-pyridazinon
- 30 *Bacillus thuringiensis* strain EG-2348

- Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid
- Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-
ester
- 5 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
- Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd
- 10 Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat
- N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin
- 15 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid
- N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin
- 20 N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid
- N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid
- O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat
- 25 N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid
- 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol
- 30 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen *Candida*-Spezies wie *Candida albicans*, *Candida glabrata*) sowie *Epidermophyton floccosum*, *Aspergillus*-Spezies wie *Aspergillus niger* und *Aspergillus fumigatus*, *Trichophyton*-Spezies wie *Trichophyton mentagrophytes*, *Microsporon*-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykologischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß
5 der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise
10 zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

15 Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekälkten Unterlagen aus.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile
20 behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls
25 in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen
30 oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch

konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

- 5 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

- Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen

Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervor-

5 gehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften

10 ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten

15 herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter

20 den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen

25 Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt.

30 Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw.

zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

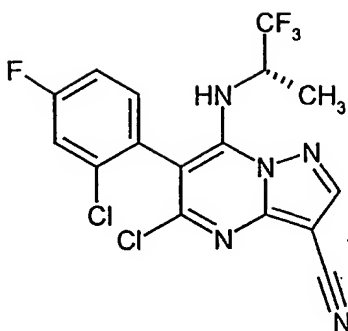
Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den
5 Verbindungen der allgemeinen Formel I bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoff-
mischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben
angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen.
Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text
speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

10

Die Erfindung wird durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

Herstellungsbeispiele

Beispiele 1 und 2



5

2,5 g (7,3 mMol) 3-Cyano-5,7-dichlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin werden mit 0,425 g (7,3 mMol) Kaliumfluorid in 7,8 g Acetonitril 3 Stunden bei 60°C gerührt. Dann gibt man 3,31 g (29,3 mMol) (S)-1,1,1-Trifluorprop-2-ylamin dazu und rührt weitere 15 Stunden bei 80°C. Man destilliert das Lösungsmittel unter vermindertem Druck ab und behandelt den Rückstand mit Dichlormethan und 1 N wässriger Salzsäure. Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet, und das Lösungsmittel wird unter vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit einer Mischung aus 4 Teilen Cyclohexan und 1 Teil Essigsäureethylester an Kieselgel chromatographiert. Es werden zwei verschiedene Produktfraktionen isoliert (Fraktion 1 und Fraktion 2).

10

Fraktion 1 (1,2 g) wird nochmals mit einem Gemisch aus 9 Teilen n-Hexan und 1 Teil Aceton an Kieselgel chromatographiert. Man erhält 0,8 g (21 % der Theorie) an 3-Cyano-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)-7-(S)-1',1',1'-trifluorprop-2-ylamino-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin als Atropisomeres A (Beispiel 1) (Gehalt: 80,4 %)

20

HPLC: logP = 3,88 (Isomer AS)

¹H-NMR (DMSO-d₆, Tetramethylsilan): δ = 1.37, 1.38 (3H); 4.88, 4.90 (1H); 7.43-7.59 (1H); 7.60-7.66 (1H); 7.72-7.78 (1H); 8.06, 8.08 (1H, NH); 8.83 (1H) ppm.

25

- 70 -

Die zuletzt isolierte Fraktion 2 enthält 0,9 g (29,3 % der Theorie) 3-Cyano-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)-7-(S)-1',1',1'-trifluorprop-2-ylamino-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin als Atropisomeres B (Beispiel 2) (Gehalt: 99,3 %)

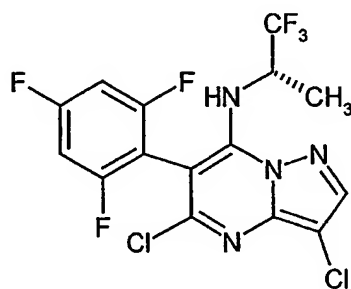
5

HPLC: logP = 3,91 (Isomer BS)

¹H-NMR (DMSO-d₆, Tetramethylsilan): δ = 1.29, 1.31 (3H); 4.61, 4.63 (1H); 7.42-7.47 (1H); 7.58-7.61 (1H); 7.73-7.76 (1H); 8.10, 8.12 (1H, NH); 8.84 (1H) ppm.

10

Beispiel 3



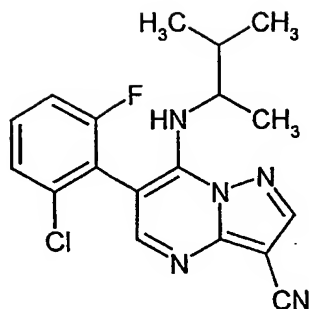
15

Zu einer Lösung von 0,5 g (1,4 mMol) 3,5,7-Trichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin in 12,5 ml Acetonitril gibt man 0,165 g (237,5 mMol) Kaliumfluorid und 0,481 g (4,26 mMol) (S)-1,1,1-Trifluorprop-2-ylamin und rührt 16 Stunden bei 80°C. Nach dem Abkühlen werden 1N Salzsäure und Dichlormethan zugegeben. Das Reaktionsgemisch wird filtriert und das Filtrat wird eingeeengt. Der Rückstand wird mit Methyl-t-butylether/Petrolether (1:100) an einer Kieselgel-

20 kartsche chromatografiert. Man erhält 0,25 g (40 % der Theorie) an N-[3,5-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7-yl]-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methylethyl]amin.

HPLC; logP = 4,43

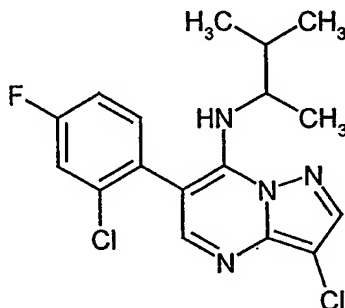
25

Beispiel 4

0,1 g (0,33 mMol) 7-Chlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-3-carbonitril und 0,028 g (0,33 mMol) 1,2-Dimethylpropylamin werden in 5 ml
5 Dichlormethan gelöst. Es werden 0,05 ml Triethylamin zugegeben, und das Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionsmischung wird mit 1N Salzsäure verrührt, dann filtriert und das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingengt. Der Rückstand wird mit Methyl-t-butyl-
10 ether/Petrolether (1:9) an einer Kieselgelkartusche chromatografiert. Man erhält 0,1 g (89 % der Theorie) an 6-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-7-[(1,2-dimethylpropyl)amino]pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-3-carbonitril.

HPLC; logP = 3,78

15

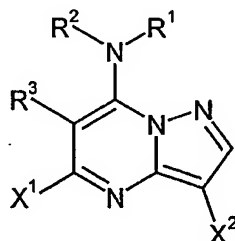
Beispiel 5

- 72 -

0,1 g (0,316 mMol) 7-Chlor-6-(2-chlor-6-fluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-3-carbonitril und 0,028 g (0,316 mMol) 1,2-Dimethylpropylamin werden in 4 ml Acetonitril gelöst. Es werden 0,044 g (0,316 mMol) Kaliumcarbonat zugegeben, und das Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei 60°C gerührt. Zur Reaktionsmischung
 5 gibt man 20 ml Ether und 10 ml 1N Salzsäure. Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit Methyl-t-butylether/Petrolether (1:30) an einer Kieselgelkartusche chromatografiert. Man erhält 0,08 g (67 % der Theorie) an N-[3-chlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7-yl]-N-(1,2-dimethylpropyl)amin.

10 HPLC; logP = 4,53

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel



(I)

hergestellt.

Tabelle 1

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer* *	logP	Fp.: (°C)
6	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,6	
7	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN	S	3,69	
8	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,38	
9	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,52	
10	Cyclopentyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,89	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
11	Cyclopropylmethyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,47	
12	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN	S	3,73	
13	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,68	
14	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,26	
15	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,92	
16	i-Butyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,94	
17	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,41	
18	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,65	
19	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,82	
20	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,13	
21	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,32	
22	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,13	
23	i-Propyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,65	
24	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,22	
25	Cyclopropyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,37	
26	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,9	
27	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,37	
28	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,77	
29	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,74	
30	2-Butyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,94	
31	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH- CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,08	
32	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,77	
33	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,51	
34	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,82	
35	Allyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,32	
36	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,32	
37	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,08	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
38	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,86	
39	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,86	
40	Propargyl	-CH ₃	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,53	
41	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,57	
42	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,49	
43	Allyl	-CH ₃	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,03	
44	(2-Furyl)-methyl	-CH ₃	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,99	
45	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,37	
46	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,51	
47	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,51	
48	i-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,85	
49	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,26	
50	2-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,89	
51	Cyclopentyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,01	
52	i-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,54	
53	Cyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,25	
54	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,63	
55	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,54	
56	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,33	
57	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,74	
58	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,5	
59	2-Butyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,7	
60	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,34	
61	n-Propyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,38	
62	i-Propyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,36	
63	Cyclohexyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,2	
64	1-Cyclohexylethyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,91	
65	2-Methoxyethyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		2,89	
66	Cyclopropyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,11	
67	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,15	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
68	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,39	
69	3-Trifluormethylcyclo-hexyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,15	
70	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,26	
71	3,5-bis-Trifluormethyl- cyclohexyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,26	
72	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,8	
73	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		2,88	
74	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN	S	3,49	
75	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN			
76	i-Butyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4	
77	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,47	
78	2-Butyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,98	
79	Cyclopentyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,19	
80	i-Propyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,64	
81	Cyclopropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,38	
82	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,74	
83	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,68	
84	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,7	
85	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,42	
86	Allyl	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,03	
87	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,5	
88	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,39	
89	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,68	
90	Allyl	-C ₂ H ₅	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,32	
91	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,18	
92	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,82	
93	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,1	
94	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,69	
95	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,78	
96	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,52	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
97	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,35	
98	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,36	
99	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,17	
100	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,88	
101	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-Cl	-CN		1,9	
102	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,18	
103	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN	S	3,79	
104	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,05	
105	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,47	95-98
106	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,55	
107	Allyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,87	
108	i-Butyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,37	
109	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,44	
110	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,24	
111	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,23	
112	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,09	
113	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,12	
114	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,71	
115	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,96	
116	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,6	
117	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,6	
118	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,34	
119	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,72	
120	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,26	
121	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,23	
122	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,16	
123	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,79	
124	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,37	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
125	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN			
126	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN	S	3,65	123-25
127	-C ₂ H ₅	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,06	
128	-CH ₂ -CN	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		2,45	
129	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,01	
130	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,2	
131	-CH ₃	-CH ₃	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,12	
132	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,56	
133	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		4,13	
134	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,67	
135	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-Cl	-CN		3,63	
136	1-Cyclopropylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,66	
137	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,43	
138	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,51	
139	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,23	
140	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,28	
141	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,19	
142	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		4,82	
143	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CN		3,81	
144	i-Propyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,78	
145	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN	AS + BR	3,87	
146	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN	AS + BR + BS + AR	3,92	
147	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN	AS + BR	3,91	
148	i-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,87	
149	n-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,86	
150	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,23	
151	2-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,82	
152	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,47	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
153	n-Propyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,5	
154	Cyclopentyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,98	
155	-i-Propyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,5	
156	Cyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,26	
157	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,96	
158	2-Methoxyethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,06	
159	Cyclopropyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,23	
160	Cyclopropylmethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,35	
161	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,51	
162	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,2	
163	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,23	
164	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,21	
165	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,47	
166	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		1,72	
167	Propargyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,35	
168	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,3	
169	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,46	
170	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,16	
171	n-Butyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,36	
172	i-Butyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,73	
173	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,15	
174	2-Butyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,71	
175	-CH ₂ -CN	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,49	
176	Cyclopentyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,89	
177	-i-Propyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,39	
178	2-Methoxyethyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,96	
179	Cyclopropyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,13	
180	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,07	
181	Cyclopropylmethyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,5	
182	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,4	
183	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,39	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
184	Propargyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,27	
185	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,31	
186	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,21	
187	Allyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,77	
188	i-Butyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,23	
189	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,27	
190	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,1	
191	Allyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,07	
192	(2-Furyl)-methyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,04	
193	(2-Tetrahydro-furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,84	
194	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,59	
195	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,61	
196	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,64	
197	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,88	
198	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,65	
199	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,24	
200	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,96	
201	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,47	
202	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,92	
203	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,55	
204	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,4	
205	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,46	
206	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,46	
207	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,2	
208	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,13	
209	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,07	
210	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,65	
211	2-Fluorocyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,06	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
212	i-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,7	
213	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,14	
214	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,61	
215	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,99	
216	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,56	
217	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,59	
218	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH- CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,84	
219	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,59	
220	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,14	
221	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		3,94	
222	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,19	
223	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,41	
224	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,08	
225	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,32	
226	Allyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,8	
227	i-Butyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,31	
228	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,23	
229	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,17	
230	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		3,81	
231	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,61	
232	(2,2-Dichlor-cyclopropyl)- methyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,32	
233	(2,2-Dichlor-cyclopropyl)- methyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,16	
234	2-Fluorocyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		3,72	
235	-C ₂ H ₅	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,2	
236	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,34	
237	3,5-bis-Trifluormethyl- cyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,41	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
238	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,49	
239	Allyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,87	
240	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,98	
241	-CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,95	
242	-CH ₂ -COOCH ₃	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,17	
243	(2-Furyl)-methyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,87	
244	i-Butyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,33	
245	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH=CH ₂	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,6	
246	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,41	
247	-CH ₃	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,25	
248	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,17	
249	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,02	
250	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,02	
251	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		5,02	
252	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,16	
253	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,16	
254	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,71	
255	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,02	
256	-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,85	
257	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN	AS + BR	4,43	
258	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN	AR + BS	4,48	
259	i-Butyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,18	
260	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,61	
261	2-Butyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,18	
262	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,32	
263	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,33	
264	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,9	
265	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,85	
266	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,67	
267	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,72	
268	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,56	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
269	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,87	
270	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,99	
271	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,32	
272	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,99	
273	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,92	
274	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,51	
275	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,33	
276	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN			
277	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN			
278	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-H	-Cl		4,43	
279	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-4-fluorphenyl	-H	-Cl		5,14	
280	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-H	-Cl		3,57	
281	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-H	-Cl		3,6	
282	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,31	
283	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,76	
284	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,33	
285	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,61	
286	-CH ₂ -CH ₂ -CHBr-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,21	
287	-CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,85	
288	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,66	
289		*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4	
290	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,2	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

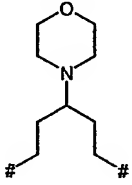
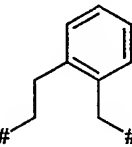
Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
291		*	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		1,74	
292	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		2,51	
293	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		1,47	
294	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		3,77	
295	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		4,18	
296	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		3,73	
297		*	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		4,38	
298	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-Cl	-CN		4,02	
299	-CH ₂ -CHF ₂	-H	2-Chlor-6-fluorophenyl	-H	-Cl		3,09	
300	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-CN		4,1	
301	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-Cl	-CN	R	3,47	
302	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-Cl	-CN	BR	4,44	
303	1,2-Di-methylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-Cl	-CN	AR	4,47	
304	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-Cl	-CN	AR + BR	4,45	
305	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-Cl	-CN	AS	4,46	
306	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-Cl	-CN	BS	4,46	
307	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorophenyl	-Cl	-CN	AS + BS	4,45	
308	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		1,83	
309	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		4,18	
310	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		4,18	
311	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		4,02	
312	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		3,24	
313	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-CN		3,74	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

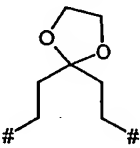
Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
314	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,81	
315	3-Aminopropyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		1,75	
316	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,45	
317	2-Thienylmethyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,8	
318	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,13	
319	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	i-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		1,72	
320	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclo- propyl	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,99	
321	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,57	
322	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,05	
323	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,7	
324	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,63	
325		*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		3,51	
326	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,98	
327	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,49	
328	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,59	
329	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,59	
330	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		2,83	
331	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-CN		4,83	
332	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,64	
333	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	B	5,17	
334	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	A	5,18	
335	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl		5,38	
336	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,25	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
337	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,26	
338	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl		3,86	
339	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl		4,67	
340	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ - CH ₂	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl		4,67	
341	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	B	4,48	
342	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	A	4,52	
343	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,01	
344	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,79	
345	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,79	
346	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,57	
347	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,2	
348	i-Butyl	-CH ₃	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN		4,48	
349	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN		4,43	
350	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH ₂	*	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN		4,71	
351	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl	B	4,63	
352	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl	A	4,62	
353	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl	B	5,26	
354	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl	A	5,25	
355	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,66	Paste
356	-NH ₂	i-Butyl	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,9	Öl
357	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN		3,44	
358	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl	A	5,04	
359	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl	B	5,05	
360	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl		5,34	
361	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		5,4	
362	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,79	
363	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl		4,68	
364	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl		4,41	
365	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl		3,9	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

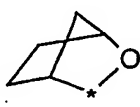
Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
366	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl	B	4,49	
367	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl	A	4,46	
368	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,78	209-11
369	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN	A	3,75	
370	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN	B	3,79	
371		*	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-Cl		4,17	
372	-NH ₂	i-Butyl	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,09	Paste
373	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl		5,77	
374	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,4	
375	-NH ₂	i-Butyl	2-Chlor-6-fluorphenyl	-H	-Cl		4,11	Öl
376	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN		4,26	
377	-NH ₂	i-Butyl	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN		3,96	128-30
378	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN	A	3,79	
379	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN	B	3,79	
380	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl		4,42	
381	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -NH-	*	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		3,23	
382	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,78	180-5
383	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,6	
384	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,51	
385	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-5-nitrophenyl	-Cl	-NO ₂		2,91	
386	1,2,2-Trimethylpropyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,59	146-8
387	1,2,2-Trimethylpropyl	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,66	145-8
388	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Trifluormethylphenyl	-Cl	-CN		4,57	
389	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		5,63	
390	1,2,2-Trimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,8	Paste
391	1,2,2-Trimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CN		4,83	Paste
392	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-Br		3,97	
393	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CSNH ₂		4,74	Paste

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
394	1,2,2-Trimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CN		4,55	
395	i-Butyl	-H	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		4,01	
396	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		4,67	
397	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		4,45	
398	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Br		5,31	
399	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂	*	2-Chlorphenyl	-Cl	I		4,13	
400	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	I		5,43	
401	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CHO		4,43	
402	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CH=N-O- CH ₃	A + B	5,48	Paste
403	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CH=N-O- CH ₃	A	5,5	Paste
404	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CH=N-O- CH ₃	B	5,57	Paste
405	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		4,33	
406	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-	*	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		4,65	
407	1,2,2-Trimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	Cyclo- propyl		5,88	
408	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-4-methylphenyl	-Cl	-CN		3,47	
409	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-CHO		3,98	
410	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		4,5	
411	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		3,26	
412	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-	*	2-Chlor-4-methoxyphenyl	-Cl	-CN		4,18	
413	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CN)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-Cl		4,06	
414	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	Cyclo- propyl		5,5	
415	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CSNH ₂		4,52	
416	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	Cyclo- propyl		5,61	
417	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Br		5,13	
418	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ - CH ₂	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Br		5,65	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
419	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Br		3,97	
420	1,2,2-Trimethylpropyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	Cyclo- propyl		5,97	
421	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH---CH}_3 \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CH ₃		4,79	
422	$\begin{array}{c} \text{---CH---C(CH}_3\text{)}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-H	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CHO		4,43	
423	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CHO		4,42	
424	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CHO		4,53	
425	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH---CH}_3 \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$	H	2-Chlor-phenyl	-Cl	-CHO		3,98	
426	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		2,78	
427	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		4,24	
428	$\begin{array}{c} \text{---CH---C(CH}_3\text{)}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl	-CHO		4,25	
429	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		3,28	
430	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		3,52	
431	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		3,74	
432	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		3,45	
433	$\begin{array}{c} \text{---CH---CF}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		3,39	
434	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CHO		2,94	
435	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-phenyl	-Cl	-CHO		3,51	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	X ¹	X ²	Isomer **	log P	Fp.: (°C)
436	$\begin{array}{c} \text{---CH---C(CH}_3\text{)}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-CHO		3,16	
437	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	*	2-Chlorphenyl	-Cl	-CHO		3,80	
438	$\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---S---CH}_2\text{---CH}_2\text{---}$	*	2-Chlor-4-fluor-phenyl	-Cl	-CHO		3,65	
439	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CHO		4,45	
440	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	*	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl	-CHO		3,95	

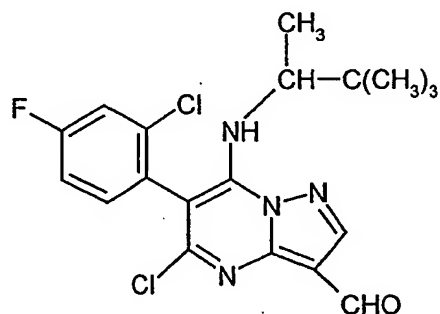
steht für die Anknüpfungsstelle

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

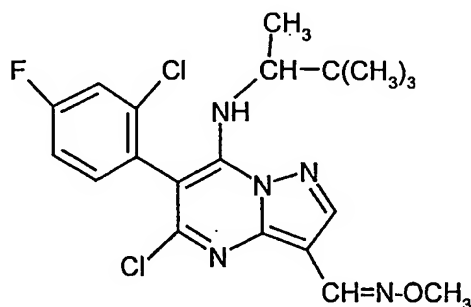
*) bedeutet, dass R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden.

**) Die Produkte wurden teilweise als Stereoisomere isoliert. "S", bzw. "R" bedeutet S- bzw. R-Konfiguration am Chiralitätszentrum; "AS" bedeutet eine eindeutige aber unbekannte Konfiguration am Atropiezentrum und S-Konfiguration am Chiralitätszentrum. BS bedeutet die jeweils andere eindeutige aber unbekannte Konfiguration am Atropiezentrum und S-Konfiguration am Chiralitätszentrum. "AR" und "BR" bedeuten wiederum die jeweiligen komplementären Konfigurationen am Atropiezentrum gepaart mit der R-Konfiguration am Chiralitätszentrum. Demnach sind bei gleichen Substituenten "AR" und "BS", sowie "AS" und "BR" jeweils Enantiomerenpaare.

- 90 -

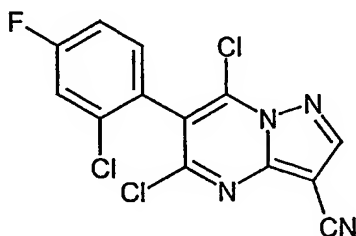
Herstellung der Verbindung gemäß Beispiel 401Verfahren b

- 5 In eine Lösung von 300 mg (0,738 mmol) 3-Cyano-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-7-(1,2,2-trimethyl-propyl-amino)-pyrazolo[1,5a]pyrimidin in 13,2 g Dichlor-methan wird unter Argonatmosphäre und unter Rühren bei -50°C langsam eine 1-molare Lösung von 649 mg (0,812 mmol) Di-isobutyl-aluminiumhydrid in Toluol eingetropft. Nach beendeter Zugabe wird noch 30 Minuten bei -50°C gerührt.
- 10 Anschließend lässt man die Temperatur des Reaktionsgemisches auf 0°C ansteigen, versetzt dann mit gesättigter, wässriger Ammoniumchlorid-Lösung und rührt 2 Stunden bei 0°C . Man versetzt mit 1-N Salzsäure, trennt die organische Phase ab und extrahiert die wässrige Phase noch dreimal mit Dichlormethan. Die vereinigten organischen Phasen werden nacheinander mit gesättigter, wässriger Natriumhydrogencarbonat-Lösung und mit gesättigter, wässriger Kochsalz-Lösung gewaschen,
- 15 über Natriumsulfat getrocknet und dann unter vermindertem Druck eingeeengt. Man erhält auf diese Weise 300 mg (99 % der Theorie) an 3-Formyl-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-7-(1,2,2-trimethyl-propylamino)-pyrazolo[1,5a]pyrimidin.
- HPLC: $\log P = 4,43$.

Herstellung der Verbindung gemäß Beispiel 402**Verfahren c**

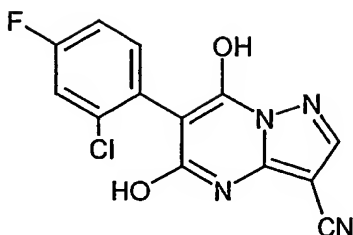
- 5 Eine Lösung von 300 mg (0,733 mmol) 3-Formyl-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-7-(1,2,2-trimethylpropylamino)-pyrazolo[1,5a]pyrimidin in 20 ml Ethanol wird bei Raumtemperatur mit 73 mg (0,880 mmol) Methoxyamin-Hydrochlorid und 1,0 g des unter der Bezeichnung Amberlyst A-21 im Handel befindlichen, schwach basischen Ionenaustauschers versetzt und 18 Stunden bei Raumtemperatur geschüttelt. Danach
- 10 wird das Reaktionsgemisch filtriert und das Filtrat unter vermindertem Druck eingeeengt. Man erhält 220 mg an 3-Methoximino-5-chlor-6-(2-chlor-4-fluor-phenyl)-7-(1,2,2-trimethyl-propylamino)-pyrazolo[1,5a]pyrimidin in Form eines Atropisomerengemisches.
- HPLC: logP = 5,48.

15

Herstellung von Vorprodukten der Formel (II)**Beispiel 441**

(II-1)

20

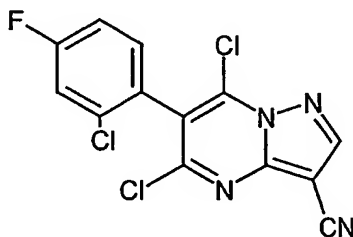
Verfahren (g):

(VI-1)

- 5 48 g (0,184 Mol) 2-Chlor-4-fluor-phenylmalonsäuredimethylester werden mit 19,91 g (0,184 Mol) 4-Cyano-5-aminopyrazol und mit 37,55 g (0,203 Mol) Tri-n-butylamin vermischt und 6 Stunden bei 180°C gerührt. Das bei der Reaktion entstehende Methanol wird abdestilliert. Anschließend wird das Reaktionsgemisch auf Raumtemperatur abgekühlt. Bei 95°C und 1 mbar werden flüchtige Komponenten
- 10 abdestilliert. Man erhält als Rückstand 6-(2-Chlor-4-fluorphenyl)-5,7-dihydroxypyrazolo[1,5-a]pyrimidin-3-carbonitril in Form eines Rohproduktes, das ohne zusätzliche Reinigung für die weitere Synthese verwendet wird.

Verfahren (e)

15



(II-1)

- Das zuvor erhaltene 6-(2-Chlor-4-fluor-phenyl)-5,7-dihydroxy-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-3-carbonitril wird im Rohzustand in 367,3 g (2,395 Mol) Phosphoroxychlorid gelöst. Man gibt bei Raumtemperatur 31,95 g (0,153 Mol) Phosphorpentachlorid in
- 20 Portionen dazu. Dann kocht man die Mischung 12 Stunden unter Rückfluss. Die flüchtigen Komponenten werden unter vermindertem Druck abdestilliert, der Rückstand wird mit Dichlormethan versetzt und mit Wasser gewaschen. Die organische

Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit 3 Teilen Cyclohexan und 1 Teil Essigsäureethylester als Laufmittel an Kieselgel chromatographiert. Man erhält 21 g 95,7 %iges 3-Cyano-5,7-dichlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin.

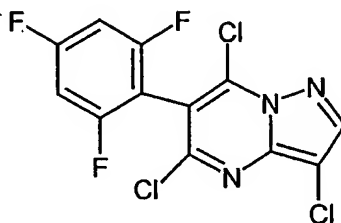
5

HPLC: logP = 3,48

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , Tetramethylsilan): δ = 7.44-7.52 (1H); 7.62-7.66 (1H); 7.71-7.77 (1H); 9.03 (1H) ppm.

10

Beispiel 442



(II-2)

Verfahren (e)

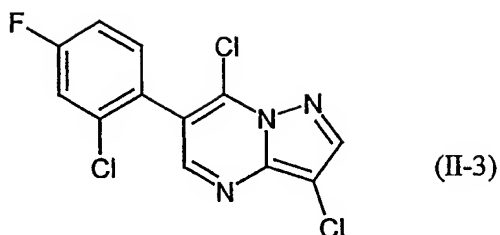
15

26 g (82,4 mMol) 3-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-5,7-diol und 8,6 g (41,2 mMol) Phosphorpentachlorid werden in 126,3 g Phosphoroxychlorid eine Stunde bei 110°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung unter Eiskühlung mit Wasser und Dichlormethan verrührt. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit Methyl-t-butylether/Petrolether (1:9) an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 5 g (16,4 % der Theorie) an 3,5,7-Trichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]-pyrimidin.

20

25

HPLC: logP = 3,97

Beispiel 443

Verfahren (d):

5

14,2 g (11,9 mMol) 25 %iges 3-Chlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ol und 1,24 g (5,9 mMol) Phosphorpentachlorid werden in 16,3 g Phosphoroxychlorid eine Stunde bei 110°C und dann 4 Stunden ohne weitere Wärmezufuhr gerührt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung unter Eiskühlung mit

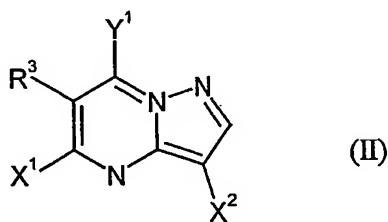
10 Wasser und Dichlormethan verrührt. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit n-Hexan/Essigsäureethylester (3:1 bis 1:1) an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 2,1 g (54 % der Theorie) an 3,7-Dichlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]-pyrimidin.

15

HPLC: logP = 3,56



Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der Formel

20



hergestellt.

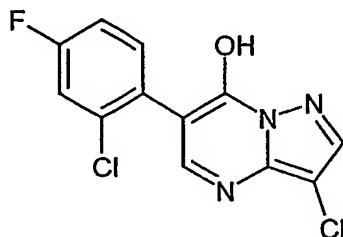
Tabelle 2

Bsp. Nr.	X ¹	Y ¹	R ³	X ²	logP	Fp.: (°C)
444	-Cl	-Cl	2-Chlor-6-fluorphenyl	-CN	3,31	
445	-Cl	-Cl	2-Chlor-4-fluorphenyl	-Cl		
446	-Cl	-Cl	2,4-Difluorphenyl	-CN	3,16	136-38
447	-Cl	-Cl	2,6-Dichlorphenyl	-CN	3,59	
448	-Cl	-Cl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CN	3,2	
449	-H	-Cl	2-Chlor-6-fluorphenyl	-CN		
450	H	-Cl	2-Chlor-6-fluorphenyl	-Cl		
451	-Cl	-Cl	2,4,6-Trifluorphenyl		4,38	
452	-Cl	-Cl	2-Chlorphenyl			

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8
 5 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

Herstellung von Vorprodukten der Formeln (V) und (VI):**Beispiel 453**

10

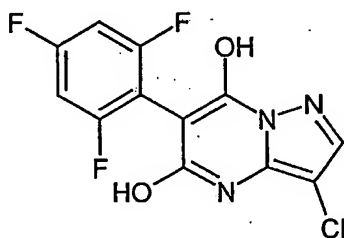


(V-1)

Verfahren (f)

- 96 -

11,3 g (43,85 mMol) 2-(2-Chlor-4-fluorphenyl)-3-(dimethylamino)-2-acrylsäuremethyl und 5,2 g (43,85 mMol) 4-Chlor-1H-pyrazol-5-amin werden in 11,5 ml Tri-n-butylamin 6 Stunden bei 180°C gerührt, wobei entstehendes Methanol und Dimethylamin abdestilliert werden. Anschließend wird die Mischung unter vermindertem Druck weiter eingengt. Man erhält 14,2 g (27 % der Theorie) 25%iges 3-Chlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ol.

Beispiel 454

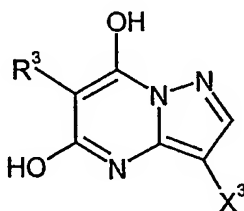
(VI-2)

10 Verfahren (g)

11,15 g (42,5 mMol) 2-(2,4,6-Trifluorphenyl)-malonsäuredimethylester und 5 g (42,5 mMol) 4-Chlor-1H-pyrazol-5-amin werden in 11,5 ml Tri-n-butylamin 3 Stunden bei 180°C gerührt, wobei entstehendes Methanol abdestilliert wird. Das Produkt wird abdekantiert. Man erhält 21 g (76 % der Theorie) 49 %iges 3-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-5,7-diol.

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle 3 aufgeführten Verbindungen der Formel



20



(VI)

hergestellt.

Tabelle 3

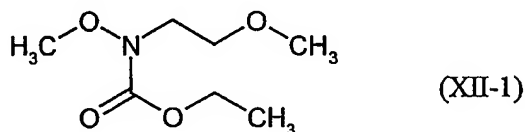
Bsp.-Nr.	R ³	X ³	log P
455	2,4,6-Trifluorophenyl		
456	2-Chlorophenyl		
457	2-Chlor-4-fluor-phenyl	-CH ₃	

5. Herstellung von Aminen der Formel (III)

Beispiel 458

Verfahren (h) erste Stufe:

10



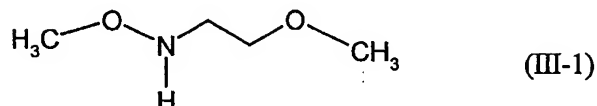
1 000 mg N-Methoxy-carbaminsäureethylester werden in 10,0 ml Dimethylformamid vorgelegt und portionsweise mit 403 mg Natriumhydrid versetzt, wobei die Temperatur durch Kühlung auf 30°C eingestellt wurde. Die Reaktionsmischung wird für 2 Stunden bei 30°C gerührt und anschließend mit 3 500 mg 2-Bromethyl-methylether versetzt. Die Reaktionsmischung wird für 18 Stunden bei 20°C bis 25°C gerührt und anschließend in 20 ml Wasser eingeleitet. Die erhaltene Reaktionsmischung wird unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt und viermal mit je 30 ml Dichlormethan extrahiert. Die organischen Extrakte werden über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt.

- 98 -

Man erhält 1 200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethyl)carbaminsäure-ethylester (Reinheit 77,6 %, Ausbeute 62,6 %).

Verfahren (h), zweite Stufe:

5



200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethyl)-carbaminsäureethylester werden in 4,0 ml wässrigem Ethanol (59 %ig) vorgelegt, mit 240,6 mg Kaliumhydroxid versetzt und für 18 Stunden bei 40°C gerührt. Die Reaktionsmischung wird dann in 50 ml Wasser eingerührt, dreimal mit je 20 ml Diethylether und dreimal mit je 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, getrocknet und bei 20°C unter vermindertem Druck auf ein Volumen von 20 ml eingengt.

15

Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 2 ml Salzsäure versetzt, 1 Stunde bei Raumtemperatur gerührt und bei 20°C unter vermindertem Druck zur Trockne eingengt.

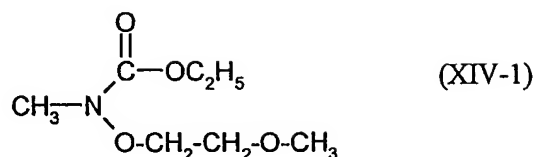
20 Das erhaltene Produkt wird dreimal mit je 15 ml Methanol digeriert und anschließend bei 20°C unter vermindertem Druck zur Trockne eingengt.

Man erhält 140 mg N-Methoxy-N-methoxyethylamin-hydrochlorid (Ausbeute 87,6 %).

25

Beispiel 459

Verfahren (i), erste Stufe:



5

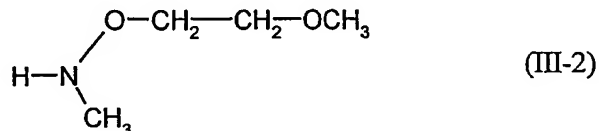
Ein Gemisch aus 1000 mg N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester, 1166 mg 2-Bromethyl-methylether wird unter Rühren auf Rückflusstemperatur erhitzt und dann tropfenweise mit einer Lösung von 493 mg Kaliumhydroxid in 5 ml Ethanol versetzt. Man kocht das Reaktionsgemisch 10 Stunden unter Rückfluss und arbeitet dann auf, indem man das Reaktionsgemisch filtriert und das Filtrat unter vermindertem Druck einengt. Der verbleibende Rückstand wird mit einem Gemisch aus Wasser und Essigsäureethylester versetzt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit gesättigter, wässriger Ammoniumchlorid-Lösung und dann mit Wasser gewaschen.

10

15

20

Verfahren (i), zweite Stufe:



25

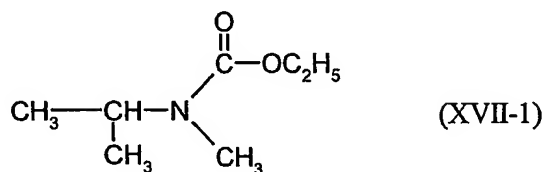
Ein Gemisch aus 200 mg (N-Methyl-N-methoxyethoxy)-carbaminsäure-ethylester, 4 ml Ethanol und 4 ml Wasser wird mit 240,6 mg pulverisiertem Kaliumhydroxid

- 100 -

versetzt und 2 Stunden bei 40°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird danach in 50 ml Wasser eingerührt, dann dreimal mit je 20 ml Diethylether und anschließend dreimal mit je 20 ml Methylenchlorid extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei Raumtemperatur unter vermindertem Druck auf ein Volumen von 20 ml eingengt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 1 ml etherischer Salzsäure versetzt. Die sich abscheidenden Kristalle werden abfiltriert und getrocknet. Man erhält auf diese Weise 190 mg an N-Methyl-N-methoxyethoxy-amin-hydrochlorid.

10 Beispiel 460

Verfahren (i), erste Stufe:

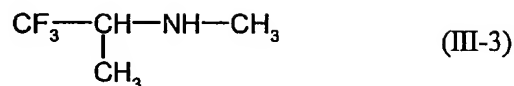


15

Ein Gemisch aus 2000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-carbaminsäure-ethylester und 20 ml Tetrahydrofuran wird bei Raumtemperatur unter Rühren mit 475 mg Natriumhydrid versetzt. Danach wird unter Rühren bei Raumtemperatur eine Lösung von 4600 mg Iodmethan in 10 ml Tetrahydrofuran hinzuge tropft. Das Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei 50°C gerührt und dann mit Wasser versetzt. Man extrahiert dreimal mit je 20 ml Methylenchlorid, trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck ein. Man erhält 1000 mg eines Produktes, das gemäß Gaschromatogramm zu 75 % aus N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methyl-carbaminsäure-ethylester besteht. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34,86 %.

25

Verfahren (j), zweite Stufe:



5

Ein Gemisch aus 1000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methyl-carbaminsäure-ethylester, 20 ml Ethanol und 20 ml Wasser wird mit 1070 mg pulverisiertem Kaliumhydroxid versetzt und 66 Stunden bei 40°C gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit Wasser verdünnt und dreimal mit je 20 ml eines Gemisches extrahiert, das zu gleichen Teilen aus Methylenchlorid und Diethylether besteht. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und dann bei Raumtemperatur unter leicht vermindertem Druck eingeeengt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit etherischer Salzsäure versetzt und 60 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach dem Einengen unter vermindertem Druck erhält man 280 mg an N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methylamin-hydrochlorid. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34 % der Theorie.

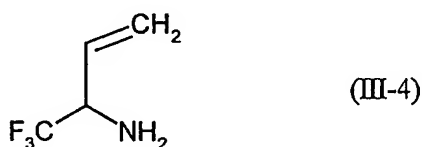
10

15

Beispiel 461

20

Verfahren (k):



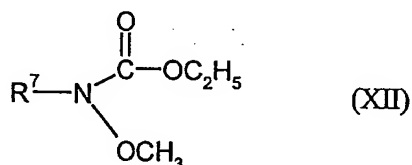
25

600 mg N-(1-Trifluormethyl-2-propen)-carbaminsäurebenzylester werden in 8,0 ml 16 %iger Salzsäure für 1,5 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach dem Abkühlen auf 20°C wird zweimal mit je 20 ml Diethylether extrahiert.

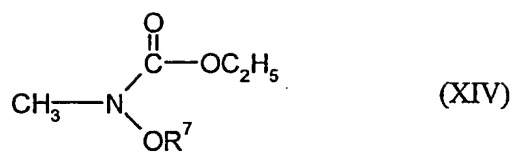
Die verbleibende wässrige Phase wird unter vermindertem Druck zur Trockne eingengt und dreimal mit je 10 ml Methanol versetzt. Nach Entfernen des Methanols unter vermindertem Druck werden 310 mg an (1-Trifluormethyl-prop-2-en)-amin-hydrochlorid isoliert. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 82,9 % der Theorie.

Nach den zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in den folgenden Tabellen angegebenen Carbamate herstellen.

10 **Tabelle 4**

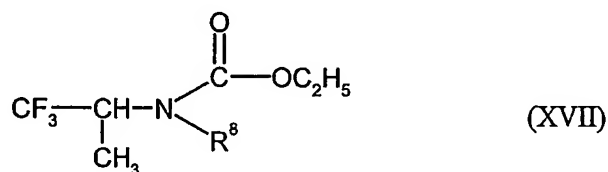


Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ⁷	logP
462	XII-2	$\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	2,38
463	XII-3	$\begin{array}{c} \text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	2,06

Tabelle 5

Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ⁷	Physikalische Konst.
464	XIV-2	$\text{CH}_2=\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}-\text{CH}_2-$	

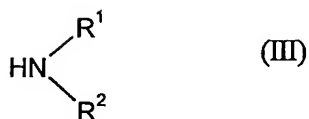
5

Tabelle 6

Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ⁸	Physikalische Konst.
465	XVII-2	-C ₂ H ₅	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ CN): δ (ppm) = 1,13 (t, <u>CH</u> ₃ CH ₂ N), 1,21 (t, <u>CH</u> ₃ CHCF ₃), 1,23 (t, <u>CH</u> ₃ CH ₂ O), 3,20 (m, <u>CH</u> ₂ N, <u>CH</u> CF ₃), 4,1 (q, CH ₃ <u>CH</u> ₂ O).

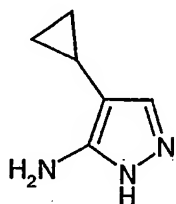
10

Nach den zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in der folgenden Tabelle aufgeführten Amine herstellen.

Tabelle 7

Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ¹	R ²	Physikal. Konst.
466	III-5	$\text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_2-$ CH_3	-OCH ₃	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ CN): δ (ppm) = 1,03 (d, <u>CH₃</u>) ₂ CH), 3,06 (d, <u>CH₂</u>), 3,28 (b, (CH ₃) ₂ <u>CH</u>), 4,01 (s, OCH ₃)
467	III-6	$\text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2-$ CH_3	-OCH ₃	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1,76 (s, <u>CH₃</u> (CCH ₂)CH ₂), 3,29 (b, NH, CH ₃ (CCH ₂) <u>CH₂</u> , OCH ₃), 7,89, 5,02 (2 s, CH ₃ (CCH ₂)CH ₂).
468	III-7	$\text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2-$ CH_3		
469	III-8	$\text{CF}_3-\text{CH}-$ CH_3	-C ₂ H ₅	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1,06 (m, <u>CH₃</u> CH ₂ N, <u>CH₃</u> CHCF ₃), 3,20 (m, <u>CH₂</u> N), 4,1 (m, <u>CH</u> CF ₃).

- 5 Die in den Beispielen 466 bis 469 aufgeführten Amine wurden jeweils in Form ihrer Hydrochloride isoliert und charakterisiert.

Herstellung eines AminopyrazolsBeispiel 470

(VIII-1)

5

a) Ein Gemisch aus 16,223 g (200 mmol) Cyclopropylacetonitril und 15,556 g (210 mmol) Ethylformiat wird unter Argonatmosphäre und unter Rühren bei Raumtemperatur innerhalb von einer Stunde in 400 ml Diethylether eingetropft. Man fügt 4,598 g (200 mmol) Natrium hinzu und rührt 4 Tage lang bei Raumtemperatur. Wenn sich das metallische Natrium gelöst hat, wird auf 10°C abgekühlt und innerhalb von 30 Minuten mit 12,01 g (200 mmol) Essigsäure versetzt, wobei das Reaktionsgemisch auf Temperaturen zwischen 10°C und 15°C gehalten wird. Man rührt 15 Minuten nach, saugt das Reaktionsgemisch dann ab und wäscht mit 30 ml kaltem Diethylether nach. Das Filtrat wird unter vermindertem Druck eingeengt. Man erhält auf diese Weise 22,0 g an 1-Formyl-1-cyclopropyl-acetonitril in Form eines Rohproduktes, das ohne vorherige Reinigung für die weitere Synthese verwendet wird.

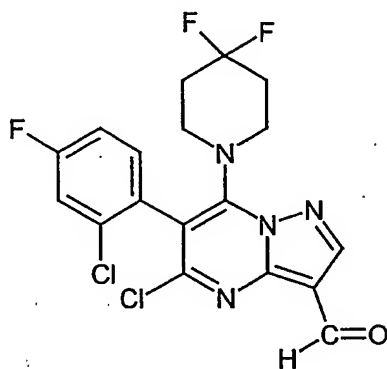
20

b) Ein Gemisch aus 8,670 g (0,173 mol) Hydrazinhydrat und 3,12 ml Essigsäure wird unter Rühren bei Raumtemperatur in eine Lösung von 21,825 g (0,200 mol) 1-Formyl-1-cyclopropyl-acetonitril in 20 ml Ethanol gegeben. Das Reaktionsgemisch wird 4 Stunden unter Rückfluß erhitzt und dann aufgearbeitet, indem man unter vermindertem Druck einengt. Man erhält 13,7 g (55,6 % der Theorie) an 4-Cyclopropyl-1H-pyrazol-5-amin.

25

Beispiel 471

Nach den zuvor angegebenen Methoden wird auch die Verbindung der Formel



log P = 3,73

Verwendungsbeispiele

Beispiel A

5 Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90% aufgestellt.

25 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

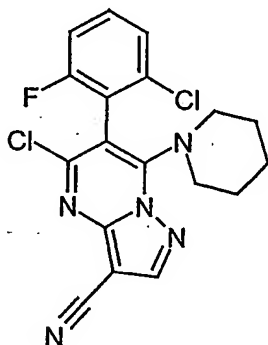
Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoffen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle A

Venturia – Test (Apfel) / protektiv

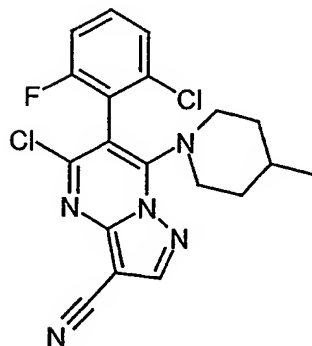
Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Wirkungs- grad in %
-----------	-------------------------	------------------------

Erfindungsgemäß:



(21)

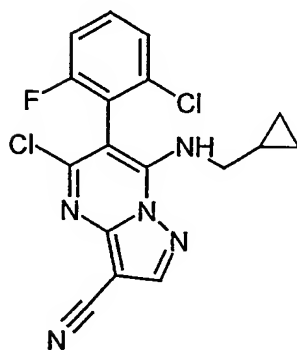
100



(28)

100

97



(29)

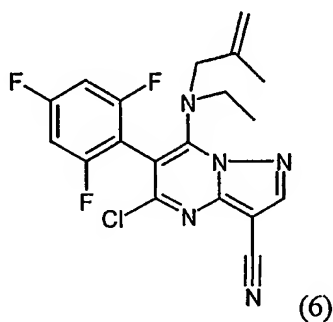
100

100

Tabelle A (Fortsetzung)

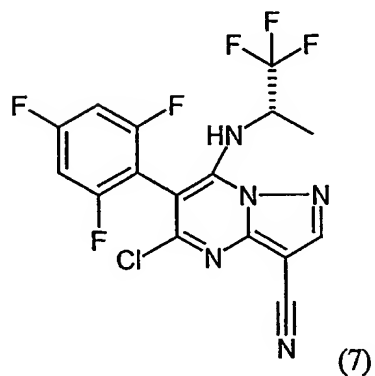
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Wirkungs- grad in %
-----------	-------------------------	------------------------



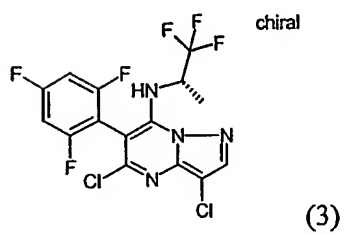
100

100



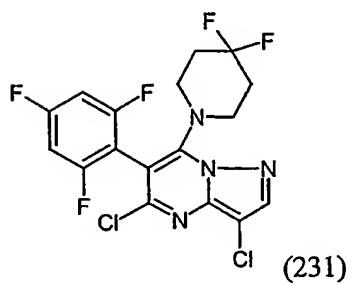
100

100



100

98



100

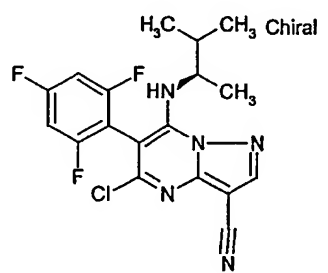
100

- 110 -

Tabelle A (Fortsetzung)

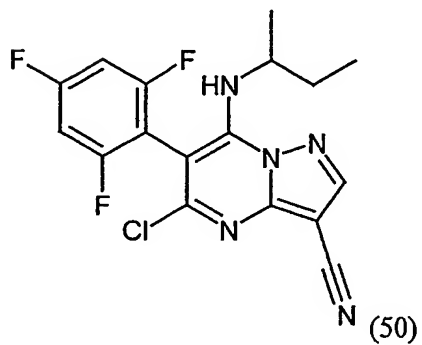
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Wirkungs- grad in %
-----------	-------------------------	------------------------



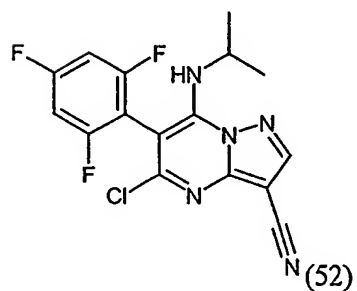
100

100



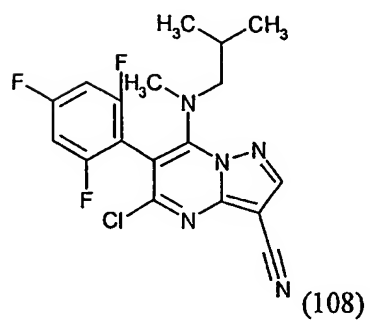
100

100



100

98



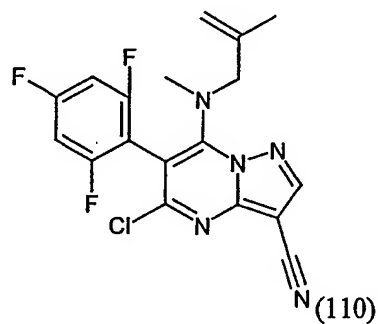
100

100

Tabelle A (Fortsetzung)

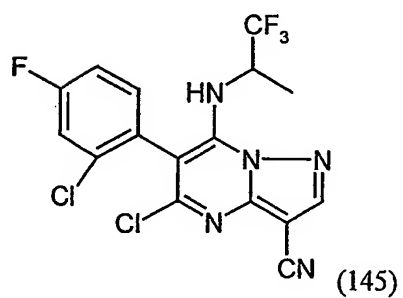
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Wirkungs- grad in %
-----------	-------------------------	------------------------



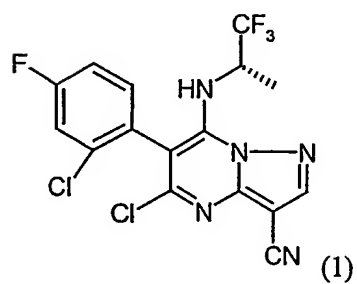
100

100



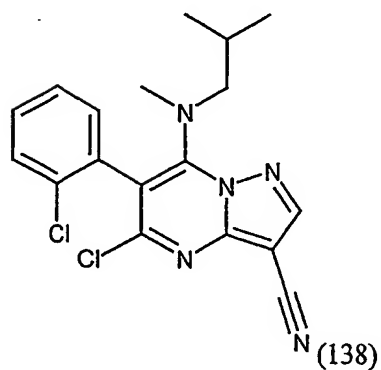
100

93



100

100



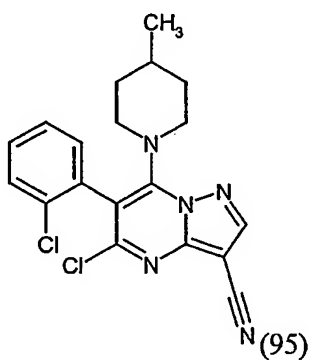
100

100

Tabelle A (Fortsetzung)

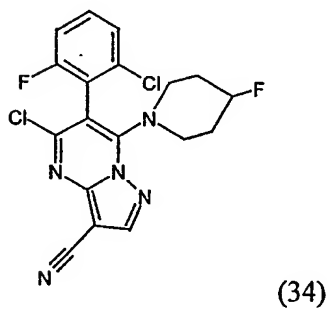
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Wirkungs- grad in %
-----------	-------------------------	------------------------



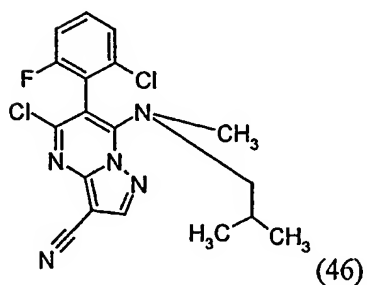
100

99



100

98



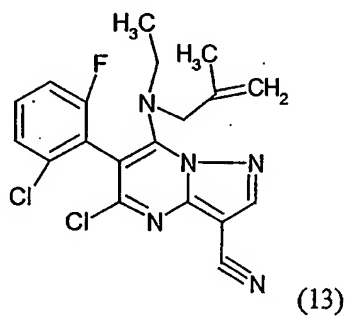
100

99

Tabelle A (Fortsetzung)

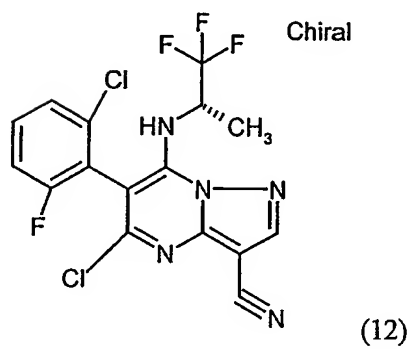
Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	----------------------	-------------------



100

100



Chiral

100

100

Beispiel B

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

- 5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykoether

- 10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

- 20 2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

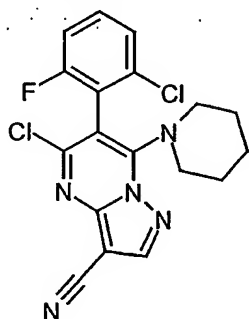
- 25 Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoffen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

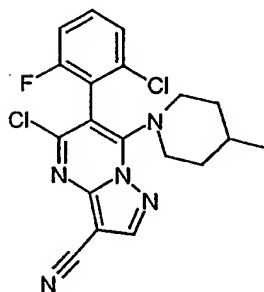
Erfindungsgemäß:



(21)

500

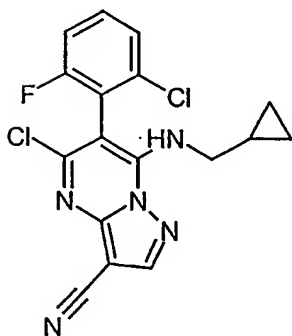
93



(28)

500

96



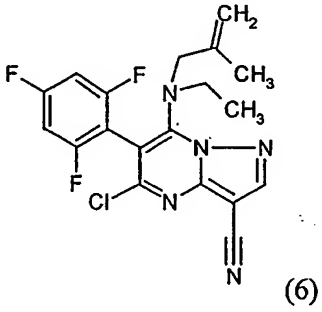
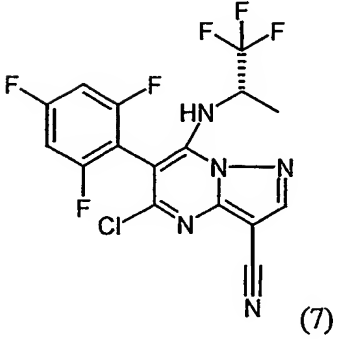
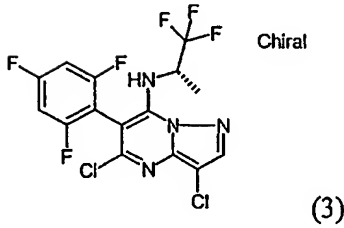
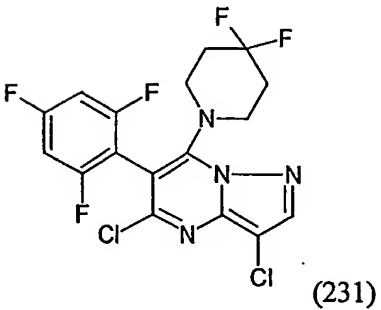
(29)

500

99

Tabelle B (Fortsetzung)

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

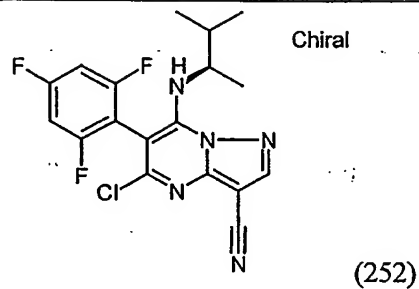
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
 (6)	500	100
 (7)	500	99
 (3)	500	100
 (231)	500	95

- 117 -

Tabelle B (Fortsetzung)

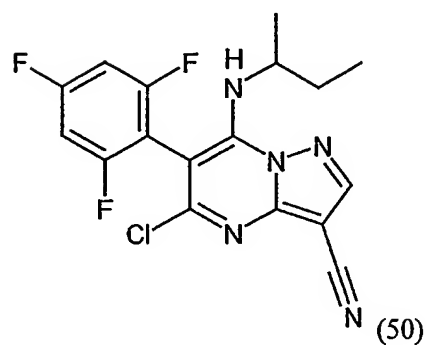
Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------



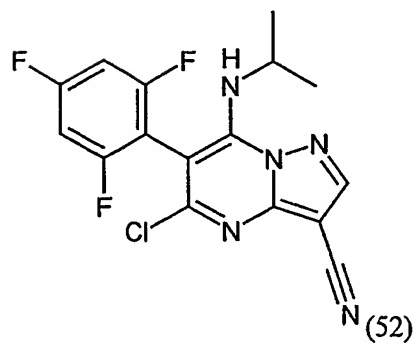
500

96



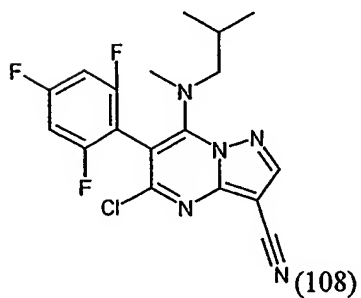
500

97



500

93



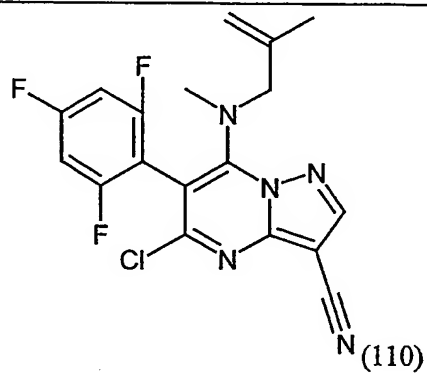
500

100

Tabelle B (Fortsetzung)

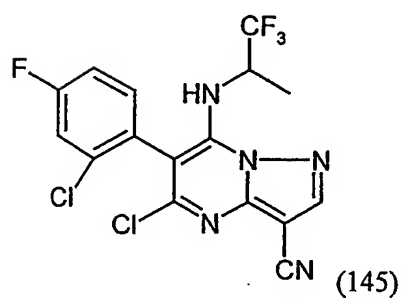
Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------



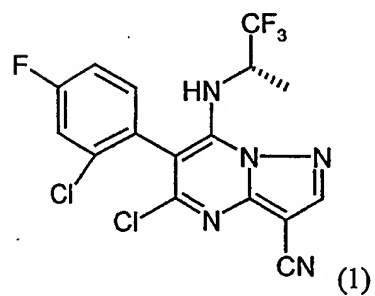
500

100



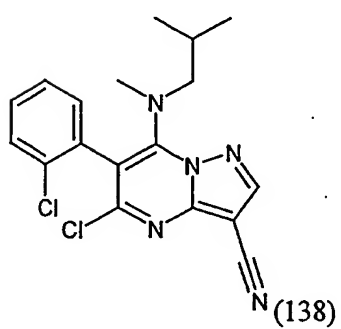
500

99



500

100



500

100

Tabelle B (Fortsetzung)

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

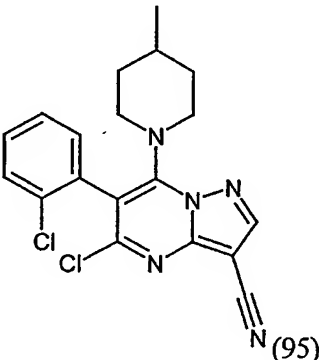
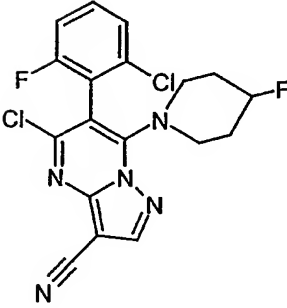
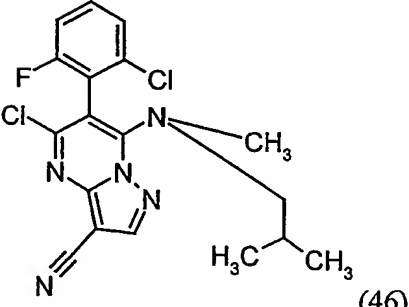
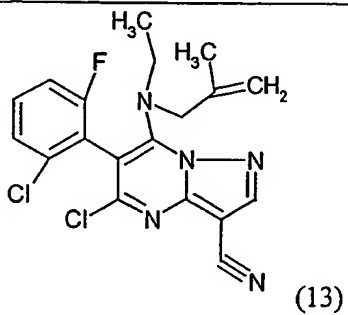
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
 (95)	500	95
 (34)	500	94
 (46)	500	99

Tabelle B (Fortsetzung)

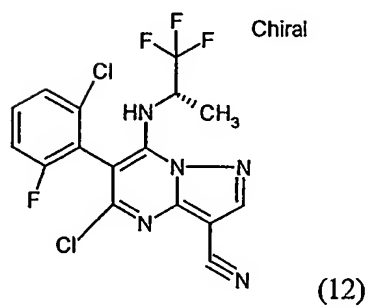
Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------



500

100



500

100

Beispiel C

Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

5

Lösungsmittel:	49 Gewichtsteile	N, N - Dimethylformamid
Emulgator:	1 Gewichtsteil	Alkylarylpolyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Tomatenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Alternaria solani* inokuliert und stehen dann 24h bei 100% rel. Feuchte und 20°C. Anschließend stehen die Pflanzen bei 96% rel. Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 20°C.

20

7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

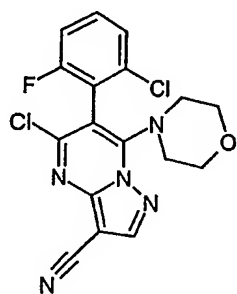
Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoffen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C

Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

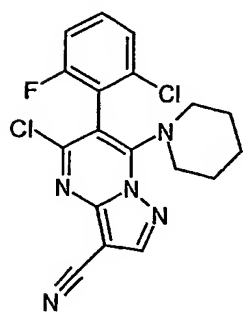
Erfindungsgemäß:



(14)

750

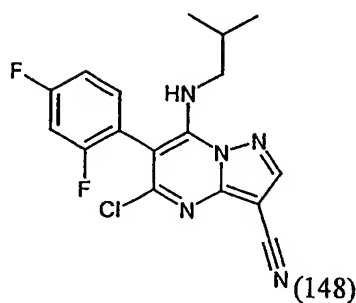
95



(21)

750

95



(148)

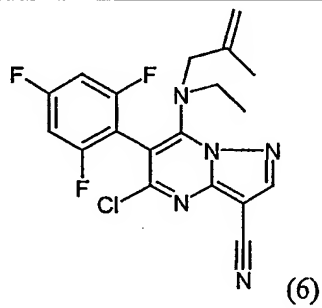
750

95

Tabelle C (Fortsetzung)

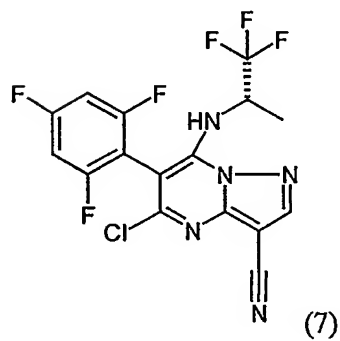
Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------



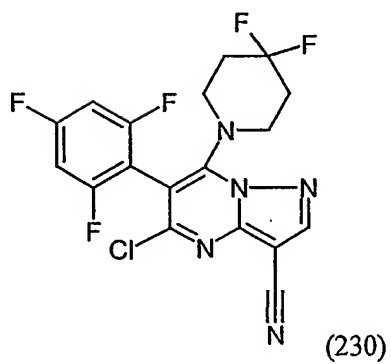
750

95



750

95



750

90

Beispiel D

Fusarium nivale (var. majus)-Test (Weizen) / protektiv

- 5 Lösungsmittel: 25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
Emulgator: 0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und
10 verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Fusarium nivale
15 (var. majus) besprüht.

Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus unter lichtdurchlässigen Inkubationshauben bei einer Temperatur von ca. 15°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 100 % aufgestellt.
20

6 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

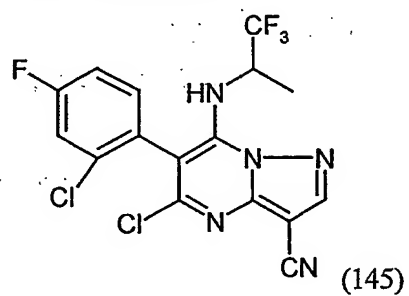
25 Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoffen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle D

Fusarium nivale (var. majus)-Test (Weizen) / protektiv

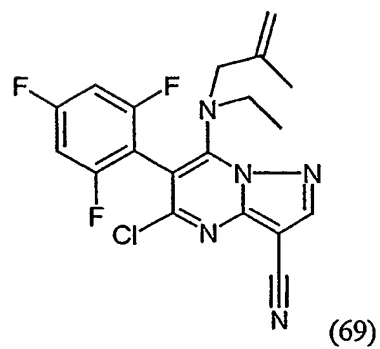
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

Erfindungsgemäß:



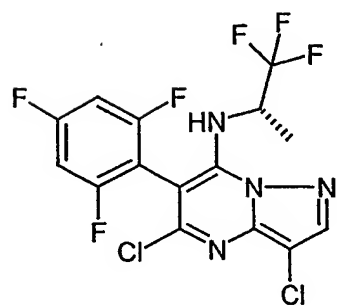
500

88



500

100



Chiral

500

80

Beispiel E

Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

- 5 Lösungsmittel: 25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
Emulgator: 0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyricularia oryzae* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und 25°C aufgestellt.

20 6 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

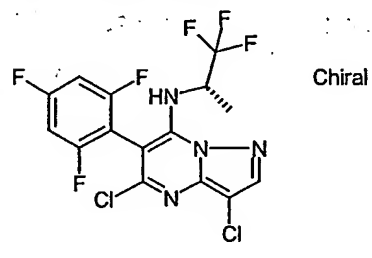
Wirkstoffe, Aufwandmengen an Wirkstoffen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle E

Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

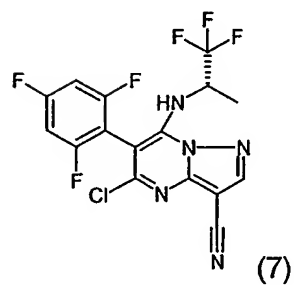
Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
-----------	--------------------------------------	----------------------

Erfindungsgemäß:



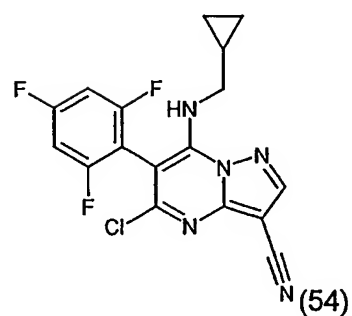
500

88



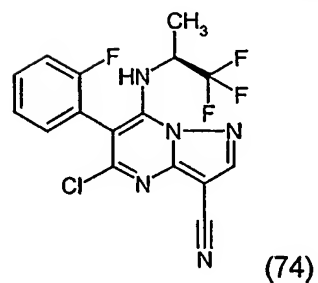
500

88



500

86



500

75

Beispiel F**Plutella-Test**

5

Lösungsmittel: 100 Gewichtsteile Aceton
 1900 Gewichtsteile Methanol

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Methanol auf die gewünschten Konzentrationen.

15 Auf eine genormte Menge Kunstfutter wird eine angegebene Menge Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration pipettiert. Nachdem das Methanol verdunstet ist, werden ca. 200-300 Eier der Kohlschabe (*Plutella xylostella*) auf das Futter gegeben.

20 Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung der Eier bzw. Larven in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Tiere abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Tiere abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

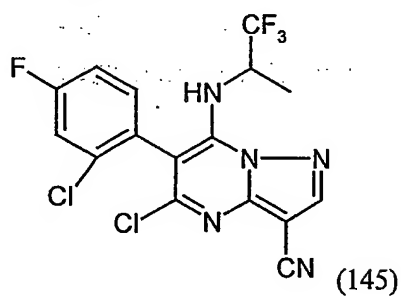
Tabelle F

pflanzenschädigende Insekten

Plutella –Test

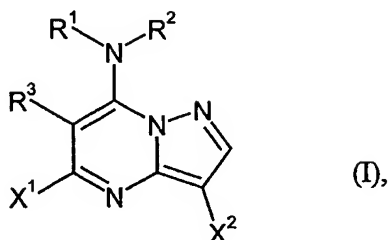
Wirkstoff	Wirkstoffkonzentra- tion in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
-----------	------------------------------------	-------------------------------

Erfindungsgemäß:



1000

100

Patentansprüche**1. Pyrazolopyrimidine der Formel**

5

in welcher

R¹ für Amino, Hydroxy oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkynylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocyclyl steht,

10

15

R² für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl oder Cycloalkyl steht, oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden,

20

R³ für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

X¹ für Wasserstoff oder Halogen steht und

25

X² für Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Formyl, Thiocarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbonyl, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl steht,

- 131 -

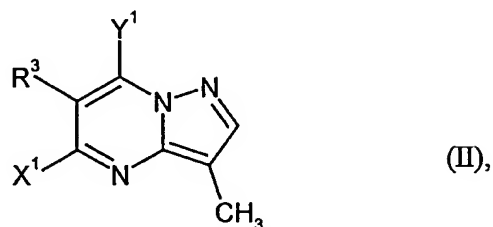
sowie Säure-Additionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I),

in denen

5 R^1 für Amino steht.

2. Verfahren zur Herstellung von Pyrazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

10 a) Halogen-pyrazolopyrimidine der Formel



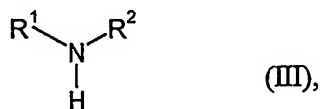
in welcher

15 R^3 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X^3 für Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Thiocarbonyl, Alkoxy-carbonyl oder Alkylcarbonyl steht und

20 Y^1 für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



25 in welcher

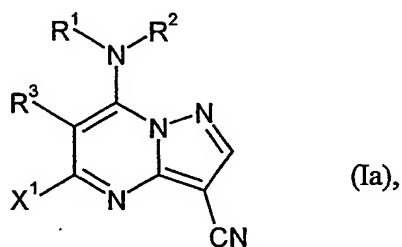
- 132 -

R^1 und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in
5 Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säure-
akzeptors, umsetzt,

oder

10 b) Pyrazolopyrimidine der Formel



in welcher

15 R^1 , R^2 , R^3 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

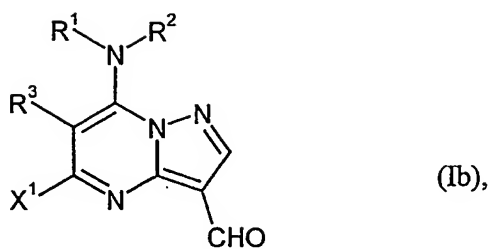
mit Diisobutyl-aluminiumhydrid, in Gegenwart von wässriger Ammonium-
chlorid-Lösung sowie in Gegenwart eines organischen Verdünnungsmittels
umsetzt,

20

oder

c) Pyrazolopyrimidine der Formel

- 133 -



in welcher

R^1 , R^2 , R^3 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Amino-Verbindungen der Formel



10

in welcher

R^4 für Wasserstoff oder Alkyl steht,

15

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt, wobei die Amino-Verbindungen der Formel (IV) auch in Form ihrer Säureadditions-Salze eingesetzt werden können,

und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen

20

R^1 für Amino steht,

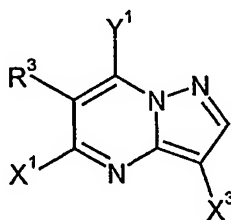
eine Säure addiert.

25

3. Mittel zur Bekämpfung von Schadorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Pyrazolopyrimidin der Formel (I) gemäß An-

spruch 1 bzw. an einem Säureadditions-Salz davon neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

4. Verwendung von Pyrazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1
5 bzw. von deren Säureadditions-Salzen zur Bekämpfung von Schadorganismen.
5. Verfahren zur Bekämpfung von Schadorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Pyrazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren
10 Säureadditions-Salze auf die Schadorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.
6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von Schadorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Pyrazolopyrimidine der Formel (I)
15 gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
7. Halogen-pyrazolopyrimidine der Formel



(II),

in welcher

R³ für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

X¹ für Wasserstoff oder Halogen steht und

- 135 -

X^3 für Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Thiocarbamoyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Alkoxy-carbonyl oder Alkylcarbonyl steht und

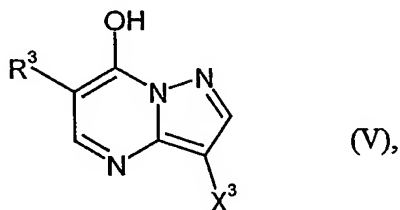
Y^1 für Halogen steht.

5

8. Verfahren zur Herstellung von Halogen-pyrazolopyrimidinen der Formel (II) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass man

d) Hydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel

10



in welcher

R^3 und X^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

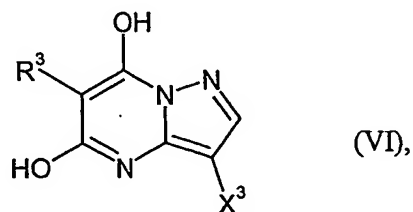
15

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

20

e) Dihydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel



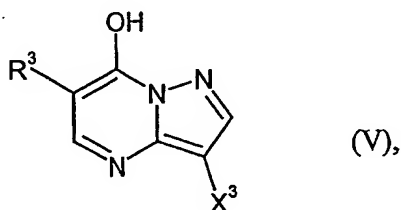
in welcher

- 136 -

R^3 und X^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels umgesetzt.

9. Hydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel



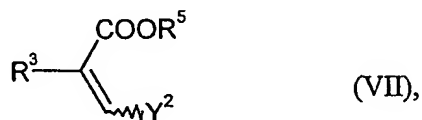
10 in welcher

R^3 für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht und

X^3 für Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Thiocarbamoyl, Cycloalkyl, Halo-
genalkyl, Alkoxycarbonyl oder Alkylcarbonyl steht.

10. Verfahren zur Herstellung von Hydroxy-pyrazolopyrimidinen der Formel (V)
gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass man

20 f) Acrylsäureester der Formel



in welcher

25 R^3 die oben angegebene Bedeutung hat,

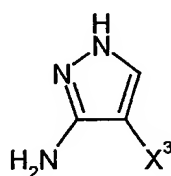
- 137 -

R⁵ für Alkyl steht und

Y² für Alkoxy oder Dialkylamino steht,

5

mit Aminopyrazolen der Formel



(VIII),

in welcher

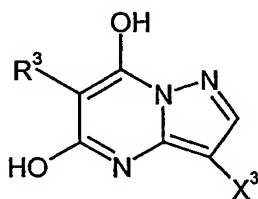
10

X³ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt.

15

11. Dihydroxy-pyrazolopyrimidine der Formel



(VI),

in welcher

20

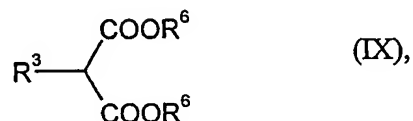
R³ für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht und

X³ für Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Thiocarbamoyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Alkoxy-carbonyl oder Alkyl-carbonyl steht.

25

12. Verfahren zur Herstellung von Dihydroxy-pyrazolopyrimidinen der Formel (VI) gemäß Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass man

g) Malonester der Formel

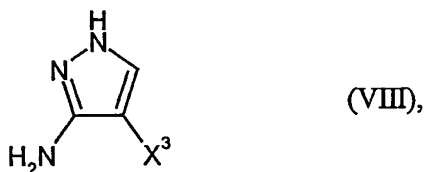


in welcher

R^3 die oben angegebenen Bedeutung hat und

R^6 für Alkyl steht,

mit Aminopyrazolen der Formel



in welcher

X^3 die oben angegebene Bedeutung hat,

- 20 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer starken Base umsetzt.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/05159

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, PAJ, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 8 April 1998 (1998-04-08) page 1 -page 5, line 47 ----	1-11
Y	FR 2 794 745 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 15 December 2000 (2000-12-15) cited in the application page 1 -page 2, line 35 ----	1-11
Y	DE 31 30 633 A (BASF AG) 17 February 1983 (1983-02-17) cited in the application page 3 -page 4, line 27 ----	1-11
Y	US 2002/049318 A1 (KLAUS JUERGEN PEES ET AL.) 25 April 2002 (2002-04-25) column 1 -column 2 -----	1-11

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- *8* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

30 October 2003

Date of mailing of the international search report

12/11/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Kyriakakou, G

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/05159

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 834513	A	08-04-1998	US 5817663 A	06-10-1998
			AT 221069 T	15-08-2002
			DE 69714171 D1	29-08-2002
			DE 69714171 T2	12-12-2002
			EP 0834513 A2	08-04-1998
			JP 10152489 A	09-06-1998
			US 5965561 A	12-10-1999
FR 2794745	A	15-12-2000	FR 2794745 A1	15-12-2000
			JP 2001019693 A	23-01-2001
DE 3130633	A	17-02-1983	DE 3130633 A1	17-02-1983
			AT 11539 T	15-02-1985
			AU 553663 B2	24-07-1986
			AU 8665982 A	10-02-1983
			CA 1180329 A1	01-01-1985
			CS 226748 B2	16-04-1984
			DD 202093 A5	31-08-1983
			DE 3262143 D1	14-03-1985
			DK 341682 A ,B,	02-02-1983
			EP 0071792 A2	16-02-1983
			GR 76193 A1	03-08-1984
			HU 188325 B	28-04-1986
			IE 53269 B1	28-09-1988
			JP 1634879 C	20-01-1992
			JP 2061955 B	21-12-1990
			JP 58043974 A	14-03-1983
			US 4567263 A	28-01-1986
			ZA 8205498 A	27-07-1983
US 2002049318	A1	25-04-2002	US 2003158190 A1	21-08-2003

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/05159

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, PAJ, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 8. April 1998 (1998-04-08) Seite 1 -Seite 5, Zeile 47 ---	1-11
Y	FR 2 794 745 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY) 15. Dezember 2000 (2000-12-15) in der Anmeldung erwähnt Seite 1 -Seite 2, Zeile 35 ---	1-11
Y	DE 31 30 633 A (BASF AG) 17. Februar 1983 (1983-02-17) in der Anmeldung erwähnt Seite 3 -Seite 4, Zeile 27 ---	1-11
Y	US 2002/049318 A1 (KLAUS JUERGEN PEES ET AL.) 25. April 2002 (2002-04-25) Spalte 1 -Spalte 2 -----	1-11

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

G Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

30. Oktober 2003

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

12/11/2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentplan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Kyriakakou, G

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/05159

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 834513	A	08-04-1998	US 5817663 A	06-10-1998
			AT 221069 T	15-08-2002
			DE 69714171 D1	29-08-2002
			DE 69714171 T2	12-12-2002
			EP 0834513 A2	08-04-1998
			JP 10152489 A	09-06-1998
			US 5965561 A	12-10-1999
FR 2794745	A	15-12-2000	FR 2794745 A1	15-12-2000
			JP 2001019693 A	23-01-2001
DE 3130633	A	17-02-1983	DE 3130633 A1	17-02-1983
			AT 11539 T	15-02-1985
			AU 553663 B2	24-07-1986
			AU 8665982 A	10-02-1983
			CA 1180329 A1	01-01-1985
			CS 226748 B2	16-04-1984
			DD 202093 A5	31-08-1983
			DE 3262143 D1	14-03-1985
			DK 341682 A ,B,	02-02-1983
			EP 0071792 A2	16-02-1983
			GR 76193 A1	03-08-1984
			HU 188325 B	28-04-1986
			IE 53269 B1	28-09-1988
			JP 1634879 C	20-01-1992
			JP 2061955 B	21-12-1990
			JP 58043974 A	14-03-1983
			US 4567263 A	28-01-1986
			ZA 8205498 A	27-07-1983
US 2002049318	A1	25-04-2002	US 2003158190 A1	21-08-2003

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.